(19) 世界知的所有権機関 国際事務局



(43) 国際公開日 2004年3月4日(04.03.2004)

PCT

(10) 国際公開番号 WO 2004/018415 A1

(51) 国際特許分類7:

C07C 311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49, C07D 213/75, 213/42, 279/12, A01N 41/06, 43/40, 47/02

(21) 国際出願番号:

PCT/JP2003/010774

(22) 国際出願日:

2003 年8 月26 日 (26.08.2003)

(25) 国際出願の言語:

日本語

(26) 国際公開の言語:

日本語

(30) 優先権データ:

2002 年8 月26 日 (26.08.2002) JP 特願2002-245264

- (71) 出願人(米国を除く全ての指定国について): 日本農 薬株式会社 (NIHON NOHYAKU CO., LTD.) [JP/JP]; 〒103-8236 東京都 中央区 日本橋1丁目2番5号 Tokyo (JP).
- (72) 発明者; および
- (75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 山口 実 (YAM-AGUCHI, Minoru) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野 市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 中尾 勇美 (NAKAO, Hayami) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会 社 総合研究所内 Osaka (JP). 後藤 誠 (GOTO, Makoto) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 森本 雅 之 (MORIMOTO, Masayuki) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪 府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合 研究所内 Osaka (JP). 藤岡 伸祐 (FUJIOKA, Shinsuke)

[JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究所内 Osaka (JP). 遠西 正 範 (TOHNISHI, Masanori) [JP/JP]; 〒586-0094 大阪府 河内長野市 小山田町345 日本農薬株式会社 総合研究 所内 Osaka (JP).

- (74) 代理人: 浅村皓, 外(ASAMURA,Kiyoshi et al.); 〒 100-0004 東京都 千代田区 大手町2丁目2番1号 新大 手町ピル331 Tokyo (JP).
- (81) 指定国(国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, KE, KG, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.
- (84) 指定国(広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア特許 (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許 (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

国際調査報告書

2文字コード及び他の略語については、 定期発行される 各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語 のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: SULFONAMIDE DERIVATIVES, INSECTICIDES FOR AGRICULTURAL AND HORTICULTURAL USE, AND USAGE THEREOF

(54) 発明の名称: スルホンアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

(57) Abstract: Sulfonamide derivatives represented by the general formula (1) or salts thereof; insecticides for agricultural and horticultural use containing the same as the active ingredient; and usage thereof: (1) [wherein A is optionally substituted C1.C6 alkylene, C₁C₆ alkenylene, or the like; R¹ is H, optionally substituted C₁-C₆ alkyl, C_3 - C_6 alkenyl, C_3 - C_6 cycloalkyl, or the like; R^2 , R^3 , and R^4 are each H, C1-C6 alkyl, C3-C6 alkenyl, or the like, or R2 and A or R2 and R1 may form a three- to eight-membered ring which may be interrupted by one to three atoms selected from among O, S, and N; Q is C or N; X and Y are each halogeno, CN, NO2, C1-C6 alkyl, C2-C6

alkenyl, or the like; m is 0 to 2; n is 0 to 3; and two adjacent Xs or Ys on the aromatic ring may be united to form a fused ring]. The compounds exhibit excellent insecticidal activity against pest insects resistant to existing pesticides even when applied in dosages lower than those of similar pesticides.

(57) 要約:

一般式(1)

$$X_{m} = \begin{pmatrix} A \cdot SO_{2} \cdot N \\ N & R^{2} \\ N & R^{3} \end{pmatrix}$$

$$(1)$$

{式中、Aは置換されていてもよい C_1 - C_6 アルキレン、 C_3 - C_6 アルケニレン等を示し; R^1 はH、置換されていてもよい C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 アルケニル、 C_3 - C_6 シクロアルキル等を示し; R^2 、 R^3 、 R^4 はH、 C_1 - C_6 アルキル、 C_3 - C_6 アルケニル等を示し、又、 R^2 とA又は R^2 と R^1 は1~3個の〇、S、Nで中断されても良い3~8員環等を形成することができる;QはC又はN;X、Yはハロゲン、CN、NO2、 C_1 - C_6 アルキル、 C_2 - C_6 アルケニル等;mは〇~2;nは〇~3を示し;芳香環上の隣接した2個のX又は2個のYは一緒になって縮合環を形成することもできる。}のスルホンアミド誘導体又はその塩及び該化合物を有効成分とする農園芸用殺虫剤並びにその使用方法を提供する。本発明の化合物は、既存農薬に対する抵抗性害虫について、類似の農薬に比して低薬量で優れた殺虫作用を示す。

1

明 細 書

スルホンアミド誘導体及び農園芸用殺虫剤並びにその使用方法

5 技術分野

本発明はスルホンアミド誘導体又はその塩類及び該化合物を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤並びにその使用方法に関するものである。

背景技術

従来、本発明のスルホンアミド誘導体に類似した化合物が農園芸用殺虫剤として有用であることが知られている(例えば、特開平11-240857号公報又は特開2001-131141号公報参照。)。しかしながら、本発明の一般式(I)で表される化合物についての実施例、物性等は示されていない。

農業及び園芸等の作物生産において、害虫等による被害は今なお大きく、既存 薬に対する抵抗性害虫の発生等の要因から新規な農園芸用殺虫剤の開発が望まれ 15 ている。又、就農者の老齢化等により各種の省力的施用方法が求められるととも に、これらの施用方法に適した性格を有する農園芸用殺虫剤の創出が求められて いる。

発明の開示

25

本発明者等は新規な農園芸用殺虫剤を開発すべく鋭意研究を重ねた結果、本発 20 明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類が文献未記載の 新規化合物であり、上記従来文献に記載される類似の化合物に対し、低薬量で効 果を示す優れた農園芸用殺虫剤であることを見出し、本発明を完成させたもので ある。

即ち、本発明は、一般式(I)

{式中、AはC1-C6アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホ ニル基、モノC1-C6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC1-C6ア ルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ トロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハ $\Box C_1 - C_6$ アルキルチオ基、 $C_1 - C_6$ アルキルスルフィニル基、ハ $\Box C_1 - C_6$ アルキルスル フィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モ \mathcal{C}_1 - \mathcal{C}_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ \mathcal{C}_1 - \mathcal{C}_6 アルキルアミ ノ基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3 - C_6 アルケニレン基、 C_3 - C_6 ア ルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト ロ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ 15 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ 基から選択される1以上の置換基を有する置換 C_3 - C_6 アルキニレン基を示す。又、 C_1 - C_6 アルキレン基、置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、置換 C_3 - C_6 アルケニレン基、C3-C6アルキニレン基又は置換C3-C6アルキニレン基中の任意の 20 飽和炭素原子はC2-C5アルキレン基で置換されてC3-C6シクロアルカン環を示すこ ともでき、C₂-C₆アルキレン基、置換C₂-C₆アルキレン基、C₃-C₆アルケニレン基又 は置換C3-C6アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアル ケニレン基と一緒になって C_3 - C_6 シクロアルカン環又は C_3 - C_6 シクロアルケン環を 25 示すこともできる。

 R^1 は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アル

キルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)ア ミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なって も良いジ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆ アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、フェノ 5 キシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C₁-C₆) アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基、(C₁-C₆) アルキルス ルフィニル基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスル ホニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基又は (C₁-C₆) アルコキシカルボ 10 ニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) ア ルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル 基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、 15 ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆ アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、モノC₁-C₆アルキルア ミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、C1-C6アルキルチオ 20 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキ ルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル 基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置 換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 25 ハロC₁-C₆アルコキシ基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い ジC₁-C₆アルキルアミノ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキ ルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基又はC₁-C₆アルコキシカルボニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以

上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケ ニル基、C₃-C₆アルキニル基、ハロC₃-C₆アルキニル基、C₃-C₆シクロアルキル基、 水酸基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、アミノ基、モノC₁-C₆アル キルアミノ基、モノ (ハロC1-C6アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良い 5 ジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)ア ミノ基、C1-C6アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆ アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、 ハロC1-C6アルキルチオ基、C1-C6アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルス 10 ルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、 モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)アミノ基、同一又は異 なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカ ルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、 15 ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト ロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキル スルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル 基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノ基、モノ(ハロ 20 C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 同一又は異なっても良いジ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカ ルボニル基又はC1-C6アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換 基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、-N=C (T^1) T^2 (式中、 T^1 及 \overline{UT}^2 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキ 25 ル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、 ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル ホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノ基、モノ

 $(\mbox{ハロC}_1\mbox{-}C_6 \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{-}C_6 \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{-}C_6 \mbox{\it F} \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{\it C}_1\mbox{-}C_6 \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{\it C}_1\mbox{\it C}_6 \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{\it C}_1\mbox{\it C}_6 \mbox{\it F} \mbox{\it V} \mbox{\it E}_1\mbox{\it C}_1\mbox{\it C}_$

C₁-C₆アルキルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)アミノ基、同一又は異なっ

10 ても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、

15 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から 選択される 1 以上の置換基を有する置換ピリジル基を示す。

 R^2 、 R^3 及び R^4 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_4 アルコキシ C_1 - C_4 アルキル基又は C_1 - C_4 アルキルチオ C_1 - C_4 アルキル基を示す。又、 R^2 はA又は R^1 と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されて も良い $3\sim 8$ 員環を形成することができ、該 $3\sim 8$ 員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 $(C_1$ - C_6) アルキル基、 $(C_1$ - C_6) アルコキシ基から選択される 1 以上の置換基を有することもできる。又、 R^2 は R^1 と一緒になって=C (T^3) T^4 (式中、 T^3 及び T^4 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、アロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ア

ミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニルチオー、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニルチオー、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニ

 C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(C_1 - C_6 アルキ

10 ル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)を示すことができる。

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、

- 15 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_1 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルメルチオールスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカー
- 20 ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホ25 ニルアミノ基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ基を示す。

又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ 基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニ ル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。mは $0\sim2$ の整数を示す。

Yは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 ホルミル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ヒドロキシ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 ヒドロキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ 10 C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキ シ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アル 15 キルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、フ ェノキシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコ キシ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルチオ基、C1-C6アルキルスルフ ィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は 20 $ハロC_1-C_6$ アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フ ェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハ $ロC_1-C_6$ アルコキシ基、 C_1-C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1-C_6 アルキルチオ基、 C_1-C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルス 25 ルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基 を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル 基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ

ィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示す。

発明を実施するための形態

本発明のスルホンアミド誘導体の一般式(I)の定義において「ハロゲン原 15 子」とは塩素原子、臭素原子、沃素原子又はフッ素原子を示し、「C1-C6アルキ ル」とは、例えばメチル、エチル、nープロピル、iープロピル、nーブチル、 iーブチル、sーブチル、tーブチル、nーペンチル、nーヘキシル等の直鎖又 は分岐鎖状の炭素原子数 $1\sim6$ 個のアルキル基を示し、「ハロ C_1 - C_6 アルキル」 とは、同一又は異なっても良い1以上のハロゲン原子により置換された直鎖又は 20 分岐鎖状の炭素原子数1~6個のアルキル基を示し、「C3-C6シクロアルキル」 とは、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル等の炭 素原子3~6個からなる環状のアルキル基を示し、「C1-C6アルキレン」とはメ チレン、エチレン、プロピレン、トリメチレン、ジメチルメチレン、テトラメチ レン、イソプチレン、ジメチルエチレン等の直鎖又は分岐鎖状の炭素原子数1~ 25 6個のアルキレン基を示し、「C2-C6アルケニレン」とは直鎖又は分岐鎖状の炭 素原子数2~6個のアルケニレン基を示し、「C2-C6アルキニレン」とは直鎖又 は分岐鎖状の炭素原子数2~6個のアルキニレン基を示す。

「縮合環」としてはナフタレン環、テトラヒドロナフタレン環、インデン環、

インダン環、キノリン環、キナゾリン環、クロマン環、イソクロマン環、インドール環、インドリン環、ベングジオキサン環、ベングジオキソール環、ベングフラン環、ジヒドロベングフラン環、ベングチオフェン環、ジヒドロベングチオフェン環、ベングオキサゾール環、ベングチアゾール環、ベンズイミダゾール環又5 はインダブール環等を例示することができる。

本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体の塩類としては、例えば塩酸塩、硫酸塩、硝酸塩、燐酸塩等の無機酸塩類、酢酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、シュウ酸塩、メタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、パラトルエンスルホン酸等の有機酸塩類、ナトリウムイオン、カリウムイオン、カルシウムイオン等との塩類を例示することができる。

本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の不斉炭素原子又は不斉中心を含む場合があり、2種以上の光学異性体及びジアステレオマーが存在する場合もあり、本発明は各々の光学異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。又、本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体は、その構造式中に1つ又は複数個の炭素-炭素二重結合又は炭素-窒素二重結合に由来する2種以上の幾何異性体が存在する場合もあるが、本発明は各々の幾何異性体及びそれらが任意の割合で含まれる混合物をも全て包含するものである。

本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体において、Aとして特 に好ましくは C_1 - C_6 アルキレン基である。 R^1 として好ましくは水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、置換 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、フェニル基又は置換フェニル基であり、特に好ましくは C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキルスルホニル C_1 - C_6 アルキル基である。 R^2 、 R^3 及び R^4 として好ましくは水素原子又は窒素原子であり、特に好ましくは炭素原子である。 R^2 として好ましくは炭素原子又は窒素原子であり、特に好ましくは炭素原子である。 R^2 として好ましくはハロゲン原子、ニトロ基、 R^2 - $R^$

mとして好ましくは1又は2であり、特に好ましくは1である。Yとして好ましくはハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ヒドロキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルコキシルロ C_1 - C_6 アルコキシ基又はハロ C_1 - C_6 アルコキシ基であり、特に好ましくは C_1 - C_6 アルキル基又はハロ C_1 - C_6 アルキル基である。nとして好ましくは $1\sim3$ の整数であり、特に好ましくは2である。

本発明の、一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体は例えば、下記に図示する製造方法により製造することができるが、これらに限定されるものではな10 い。

製造方法

(式中、A、R¹~R⁴、X、Y、n、m及びQは前記に同じ。)

本反応は J. Med. Chem., 10,982(1967)、特開平11-240857号公報、特開2001-131141号公報等に開示の方法に従い 製造することができる。即ち、一般式(II)で表されるフタル酸無水物類と一般式(III)で表されるアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に反応させることにより、一般式(V-1)で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類(V-1)を単離し又は単離せずして、R⁴が水素原子を示すフタルアミド酸類(V-1)の場合、塩基の存在下又は非存 10 在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式(VI-1)で表

されるイソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体(VI-1)を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類と反応させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができ、R⁴が水素原子り外の置換基を示すフタルアミド酸類 (V-1) の場合、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類とを塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

又、一般式 (II) で表されるフタル酸無水物類と一般式 (IV) で表されるス 10 ルファモイルアミン類とを、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性 溶媒の存在下に反応させることにより、一般式 (V-2) で表されるフタルアミド酸類とし、該フタルアミド酸類 (V-2) を単離し又は単離せずして、R³が水素原子を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、塩基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合反応を行い、一般式 (VI-2) で表される イソイミド誘導体とし、該イソイミド誘導体 (VI-2) を単離し又は単離せずして、塩基又は酸触媒の存在下若しくは非存在下、不活性溶媒の存在下に一般式 (III) で表されるアミン類と反応させることにより、一般式 (I) で表される スルホンアミド誘導体を製造することができ、R³が水素原子以外の置換基を示すフタルアミド酸類 (V-2) の場合、一般式 (III) で表されるアミン類とを塩 基の存在下又は非存在下、縮合剤及び不活性溶媒の存在下に縮合させることにより、一般式 (I) で表されるスルホンアミド誘導体を製造することができる。

1. 一般式 (II) → 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2)

本反応で使用できる酸としては、例えば酢酸、トリフルオロ酢酸等の有機酸類、塩酸、硫酸等の無機酸類を例示することができ、その使用量は、一般式(II)で 表されるフタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して 使用すれば良い。塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩 基類、炭酸カリウム、炭酸水素ナトリウム、炭酸ナトリウム、水酸化ナトリウム 等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は、一般式(II)で表される フタル酸無水物類に対して触媒量乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれ

ば良い。

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えばベンゼン、トルエン、キシレン等の芳香族炭化水素類、塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化炭化水素類、クロロベンゼン等のハロゲン化芳香族炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は環状エーテル類、酢酸エチル等のエステル類、ジメチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等のアミド類、酢酸等の酸類、ジメチルスルホキシド、1、3ージメチルー2ーイミダブリジノン等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は2種以上10 混合して使用することができる。

本反応は等モル反応であるので、各反応剤を等モル使用すれば良いが、いずれ かを過剰に使用することもできる。

反応温度は室温乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間 は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良 15 い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の 反応に使用することができる。

一般式(II)で表されるフタル酸無水物類は J. Org. Chem., <u>52</u>, 129 (1987)、 J. Am. Chem. Soc., <u>51</u>, 1865 (192
20 9)、及び J. Am. Chem. Soc., <u>63</u>, 1542 (1941) 等に記載の方法により製造することができる。

2. 一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2) → 一般式 (I)

本反応で使用する不活性溶媒としては、本反応の進行を著しく阻害しないものであれば良く、例えば塩化メチレン、クロロホルム、四塩化炭素等のハロゲン化 55 炭化水素類、ジエチルエーテル、ジオキサン、テトラヒドロフラン等の鎖状又は 環状エーテル類、アセトニトリル等のニトリル類等の不活性溶媒を例示することができ、これらの不活性溶媒は単独で又は 2種以上混合して使用することができる。

本反応で使用する縮合剤としては、通常のアミド製造に使用されるものであれ

ば良く、例えば無水トリフルオロ酢酸、クロロ炭酸エステル、向山試薬(2-クロロ-N-メチルピリジニウムヨージド)、DCC(1,3-ジシクロヘキシルカルボジイミド)、CDI(カルボニルジイミダゾール)、DEPC(シアノリン酸ジエチル)等を例示することができ、その使用量は一般式(V-1)又は(V-2)で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

本反応で使用できる塩基としては、例えばトリエチルアミン、ピリジン等の有機塩基類、炭酸カリウム等の無機塩基類を例示することができ、その使用量は一般式 (V-1) 又は一般式 (V-2) で表されるフタルアミド酸類に対して等モル乃 至過剰モルの範囲から適宜選択して使用すれば良い。

反応温度は0℃乃至使用する不活性溶媒の沸点域で行うことができ、反応時間は反応規模、反応温度により一定しないが、数分乃至48時間の範囲で行えば良い。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じ 15 て再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造する ことができる。

3. 一般式 (V-1) → 一般式 (VI-1) 又は 一般式 (V-2) → 一般式 (VI-2)

本反応は、例えば J. Med. Chem., <u>10</u>, 982 (1967) に記載 20 の方法に従って目的物を製造することができる。

反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離し又は単離せずして次の 反応に使用することができる。

4. 一般式 (VI-1) 又は一般式 (VI-2) → 一般式 (I)

本反応は1. と同様にすることにより、目的物を製造することができる。

25 反応終了後、目的物を含む反応系から常法により単離すれば良く、必要に応じて再結晶、カラムクロマトグラフィー等で精製することにより目的物を製造することができる。

原料であるスルファモイルアミン類 (IV) は例えば以下に図示する文献記載の 方法に準じて製造することができる。

(式中、 R^1 、 R^2 、 R^3 及びAは前記に同じくし、 R^5 はベンジルオキシカルボニル基、ターシャリープトキシカルボニル基、アルキルシリル基等の保護基を示し、 R^6 は C_1 - C_6 アルキル基を示し、 L^1 、 L^2 及び L^3 はハロゲン原子等の脱離基を示し、Me t はナトリウム、カリウム等の金属原子を示し、Zは水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基又はベンジル基を示す。)

(A). 一般式 (VII-1) → 一般式 (IV)

一般式 (VII-1) で表されるアミン誘導体を J. Am. Chem. Soc., 58, 1348 (1936)、 J. Am. Chem. Soc., 60, 1486 (1938)等に記載の方法に従い、チオール類と反応させることによりチオアルキルアミン誘導体 (VIII-1)とし、該チオアルキルアミン誘導体を単離し又は単離せずして、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、該スルホニルハライド誘導体を

Synthesis, <u>1970</u>, 545, J. Org. Chem., <u>21</u>, 66

7(1956) 等に記載の方法に従い、一般式(X)で表されるアミン類と反応させることにより一般式(IV-1)で表されるスルホンアミド誘導体とし、該スルホンアミド誘導体を常法に従い脱保護反応を行うことにより、一般式(IV)で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。

- 5 (B). 一般式 (VII-2) → 一般式 (IV)
 - 一般式(VII-2)で表されるジスルフィド誘導体をSynth.

Commun., <u>27</u>, 1321 (1997)、Synthesis, <u>1988</u>, 252等に記載の方法に従い、スルフェン酸エステル誘導体 (VIII-2) とし、 該スルフェン酸エステル誘導体を単離し又は単離せずして、加水分解反応を行い、

- 10 J. Am. Chem. Soc., <u>45</u>, 1068 (1923) 等に記載の方法に従い、ハロゲン類と反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。
 - (C). 一般式 (VII-3) → 一般式 (IV)
- 15 一般式 (VII-3) で表されるアミン誘導体を J. Org. Chem., 20, 1159 (1955) 等に記載の方法に従い、グリニャール試薬 (VIII-3) とし、スルフリルクロライドと反応させることにより、一般式 (IX) で表されるスルホニルハライド誘導体とし、以下 (A) と同様にして一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することができる。
- 20 (D). 一般式 (VII-4) → 一般式 (IV)

一般式 (VII-4) で表されるスルフェン酸誘導体と一般式 (X) で表されるアミン誘導体から J. Am. Chem. Soc., <u>57</u>, 2172 (1935)、Chem. Lett, 1976, 149 等に記載の方法に従い、一般式 (VIII -4) で表されるスルフェンアミド誘導体とし、該スルフェンアミド誘導体を、

- 25 J. Org. Chem., <u>31</u>, 2357 (1966) 等に記載の方法に従い、 一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下(A) と同様に脱 保護することにより、一般式(IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造す ることができる。
 - (E). 一般式 (VII-5) → 一般式 (IV)

一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミンのうち、R¹及びR²が水素原子であるスルファモイルアミンは一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体とヒドロキシルアミン-O-スルホン酸 (XI) からSynthesis, 1985,1032 に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホン アミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、製造することができる。また、一般式 (VII-5) で表されるスルフェン酸塩誘導体と一般式 (XII) で表されるN-ハロ置換アミン類から、J. Org. Chem.,46,5077 (1981) に記載の方法に従い、一般式 (IV-1) で表されるスルホンアミド誘導体とし、以下 (A) と同様に脱保護することにより、一般式 (IV) で表されるスルファモイルアミン類を製造することもできる。

以下に一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体の代表的な化合物を第1表及び第2表に例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。以下の表において、「n」はノルマルを、「s」はセカンダリーを、「t」はターシャリーを、「i」はイソを、「c」はシクロを、「Me」はメチル基を、「Et」はエチル基を、「Pr」はプロピル基を、「Bu」はブチル基を、「Pen」はペンチル基を、「Hex」はヘキシル基を、「Ph」はフェニル基を、「Py」はピリジル基を、「C*」は不斉炭素を示す。又、「J¹」、「J²」、「J³」は以下に表わされる置換基を示す。

20

一般式(I-1)

第1表

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	217-219
1-2	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	186-188
1-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	122-125
1-4	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	170-172
1-5	CHMeCH ₂ SO ₂ N(Me)Et	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-6	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	116
1-7	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	147-150
1-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	204-206
1-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pr	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-10	$\texttt{CHMeCH}_2 \texttt{SO}_2 \texttt{N(n-Pr)}_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-11	CHMeCH ₂ SO ₂ N(i-Pr) ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	178-18
1-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-s-Bu	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	
1-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-t-Bu	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	195-19
1-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Bu	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Bu	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Pen	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-c-Hex	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -c-Pr	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	109-11
1-21	$CHMeCH_2SO_2NHCH_2C \!\equiv\! CH$	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	111-11
1-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	200-20
1-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-F-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	195–19
1-24	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-C1-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	193-19
1-25	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-Br-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	189-19
1-26	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-Me-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-27	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-OMe-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	180-18
1-28	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2-NO ₂ -Ph)	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	173-17

4 1

Νο	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-29	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-OMe-Ph)	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}\left(\text{CF}_{3}\right)_{2}$	196-198
1-30	$CHMeCH_2SO_2NHCH_2-(3-NO_2-Ph)$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	155-160
1-31	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(3-CN-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	147-150
1-32	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(2, 6-(OMe) ₂ -Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	210-213
1-33	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-Cl-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-34	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-Me-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-35	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-MeO-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	176-179
1-36	$\texttt{CHMeCH}_2 \texttt{SO}_2 \texttt{NHCH}_2 (4-\texttt{NO}_2-\texttt{Ph})$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	185-187
1-37	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-CN-Ph)	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	169-171
1-38	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -(4-SCF ₃ -Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	201-204
1-39	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -2-Py	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	228-231
1-40	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -3-Py	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	144-147
1-41	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ -4-Py	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	166-168
1-42	${\rm CHMeCH_2SO_2N(Me)CH_2Ph}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	186-189
1-43	${\rm CHMeCH_2SO_2N(Et)CH_2Ph}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	184-186
1-44	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHCH}({\it Me}){\it Ph}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	173-175
1-45	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC [*] H(Me)Ph R-enantiomer	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	168-170
1-46	CHMeCH ₂ SO ₂ NHC*H(Me)Ph S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	159-161
1-47	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ Ph	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	203-206
1-48	${\rm CHMeCH_2SO_2NHC(Me)_2CH_2Ph}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	197-198
1-49	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂) ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-50	${\rm CHMeCH_2SO_2N(CH_2)_3}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-51	${\rm CHMeCH_2SO_2N(CH_2)_4}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-52	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2\right)_5$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-53	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2\right)_6$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-54	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2N}\left(\mathrm{CH_2CH_2}\right){_2}\mathrm{O}$	3-I	$2 extsf{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	204-207
1-55	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2N}\left(\mathrm{CH_2CH_2}\right){_2}\mathrm{S}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	191-194
1-56	CHMeCH ₂ SO ₂ N(CH ₂ CH ₂) ₂ SO	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	195-198

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-57	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2CH_2\right){}_2SO_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}\left(\text{CF}_{3}\right)_{2}$	237-240
1-58	$\mathrm{CMe_2CH_2'SO_2N}\left(\mathrm{CH_2CH_2}\right)_2\mathrm{S}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	164-165
1-59	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2N}\left(\mathrm{CH_2CH_2}\right)_2\mathrm{SO}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	167-168
1-60	$CMe_2CH_2SO_2N\left(CH_2CH_2\right){}_2SO_2$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	166-167
1-61	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2\ J}^{\ 1}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	207-208
1-62	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2\ J}^2$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-63	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2}\;\mathrm{J}^3$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	157-159
1-64	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2CH_2\right){}_2NH$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	
1-65	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2CH_2\right){}_2NMe$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-66	${\rm CHMeCH_2SO_2N(CH_2CH_2)_2NCOMe}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	196-198
1-67	$CHMeCH_2SO_2N\left(CH_2CH_2\right){}_2C{=}0$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	209-211
1-68	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CF ₃	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-69	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH (Me) CF ₃	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-70	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CCl ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-71	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right){_2}\mathrm{C1}$	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	90-95
1-72	${\rm CHMeCH_2SO_2NH(CH_2)_2OH}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	171-174
1-73	${\rm CHMeCH_2SO_2NH(CH_2)_2OMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	142-144
1-74	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHCHMeCH}_2{\it OMe}$	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF(CF_3)_2$	
1-75	${\rm CHMeCH_2SO_2NH(CH_2)_2SMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	156-158
1-76	${\rm CHMeCH_2SO_2NH(CH_2)_2SOMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	132-134
1-77	${\rm CHMeCH_2SO_2NH(CH_2)_2SO_2Me}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	186-189
1-78	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right)_2\mathrm{OH}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	150-151
1-79	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right)$ $_2\mathrm{OMe}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	167-168
1-80	${ m CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2OCOMe}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	181-182
1-81	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	161-162
1-82	${ m CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SOMe}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	154-155
1-83	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SO_2Me}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	151-152
1-84	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right){}_2\mathrm{SEt}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	166-167
1-85	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SOEt}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	144-145

No	-A-S O ₂ N R ¹ R ²	X _m	Yn	物性 融点℃
1-86	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH(CH ₂) ₂ SO ₂ Et	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	168-169
1-87	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SPh}$	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	155-156
1-88	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SOPh}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	151-153
1-89	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_2SO_2Ph}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	170-172
1-90	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right)_2\mathrm{NMe_2}$	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	
1-91	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHCHMeCH}_2{\it SMe}$	3-I	$2 ext{-Me} ext{-4-CF(CF}_3)_2$	190-193
1-92	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCHMeCH ₂ SOMe	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	130-133
1-93	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHCHMeCH}_2{\it SO}_2{\it Me}$	3-1	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF (CF}_3)_2$	150-154
1-94	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NCMe}_2{\it CH}_2{\it SMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	157-160
1-95	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NH}({\it CH}_2)_3{\it OMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-96	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right)_3\mathrm{SMe}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-97	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH}\left(\mathrm{CH_2}\right)_3\mathrm{SOMe}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-98	${\rm CMe_2CH_2SO_2NH(CH_2)_3SO_2Me}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-99	$CHMeCH_2SO_2NHCH_2CN$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-100	$CHMeCH_2SO_2NHCH_2CO_2Me$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-101	$\mathtt{CHMeCH_2SO_2NHCH_2CO_2Et}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-102	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2NHCHMeCO_2Me}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-103	$CHMeCH_2SO_2NHCHMeCONH_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	228-230
1-104	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHCHMeCONHEt}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	176-177
1-105	$CHMeCH_2SO_2NHCH_2CONEt_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	172-174
1-106	CHMeCH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	232-234
1-107	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-F-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	211-212
1-108	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(2-MeO-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	101-106
1-109	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(3-F-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	235-236
1-110	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-F-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	228-233
1-111	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeO-Ph)	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	143-147
1-112	CHMeCH ₂ SO ₂ NH(4-MeS-Ph)	3-I	$2 extsf{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	165-170
1-113	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-114	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-3-Py	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-115	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOH	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-116	CHMeCH ₂ SO ₂ NHOMe	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	200-205
1-117	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeOMe	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-118	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNH ₂	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-119	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNH ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-120	CHMeCH ₂ SO ₂ NMeNHMe	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-121	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNMe ₂	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	161-166
1-122	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHPh	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-123	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-124	CHMeCH ₂ SO ₂ NHNHCOPh	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
1-125	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-126	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=CHPh	3-I	2-Me-4-CF (CF ₃) ₂	
1-127	CHMeCH ₂ SO ₂ NHN=C (Me) Ph	3-I	2 -Me- 4 -CF (CF $_3$) $_2$	
1-128	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHMe	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-129	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHEt	3-I	2-Me-4-CF (CF ₃) ₂	
1-130	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CH-i-Pr	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
1-131	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHPh	3-1	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
1-132	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNHMe	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}(\text{CF}_3)_2$	
1-133	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNMe ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-134	CHMeCH ₂ SO ₂ N=CHNEt ₂	3-I	2-Me-4-CF (CF ₃) ₂	
1-135		3-I	2-Me-4-CF (CF ₃) ₂	
	R-enantiomer			
1-136	o macongoogang	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-137	S-enantiomer	3-I	9 W- 4 CE (CE)	
1 101	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHMe R-enantiomer	0 1	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-138		3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	S-enantiomer		ý <u>-</u>	
1-139	C TimeCrigoOgrane2	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
	R-enantiomer			

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Yn	物性 融点℃
1-140	C*HMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-141	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHEt R-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-142	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	105-107
1-143	C*HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ R-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-144	C*HMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	159-163
1-145		3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-146	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	158-159
1-147	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMeCH ₂ SMe S, S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-148	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMeCH ₂ SOMe S, S-enantiomer	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	115-120
1-149	C*HMeCH ₂ SO ₂ NHC*HMeCH ₂ SO ₂ Me S, S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-150	CHMeSO ₂ NH ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-151	CHMeSO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-152	CHMeSO ₂ NMe ₂	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-153	CHMeSO ₂ NHEt	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-154	CHMeSO ₂ NEt ₂	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-155	CHMe (CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-156	CHMe (CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-157	CHMe (CH $_2$) $_2$ SO $_2$ NMe $_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-158	CHMe (CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-159	CHMe (CH ₂) $_2$ SO $_2$ NEt $_2$	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-160	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NH ₂ S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

Νο	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-161	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe S-enantiomer	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-162	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NMe ₂ S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-163	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt S-enantiomer	3-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-164	C*HMe(CH ₂) ₂ SO ₂ NEt ₂ S-enantiomer	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-165	${ m CHMe}({ m CH}_2)_3 { m SO}_2 { m NH}_2$	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	
1-166	CHMe (CH ₂) ₃ SO ₂ NHMe	3-I	$2 extsf{-Me} extsf{-4} extsf{-CF}\left(extsf{CF}_{3} ight)_{2}$	
1-167	${\rm CHMe}\left({\rm CH_2}\right){_3}{\rm SO_2}{\rm NMe_2}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-168	CHMe (CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-169	CHMe(CH ₂) ₃ SO ₂ NEt ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-170	$CHMe\left(CH_{2}\right){}_{4}SO_{2}NH_{2}$	3-1	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-171	CHMe (CH ₂) ₄ SO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-172	${\rm CHMe}({\rm CH_2}){_4{\rm SO_2}}{\rm NMe_2}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-173	CHMe (CH ₂) ₄ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-174	$CHMe\left(CH_{2}\right){}_{4}SO_{2}NEt_{2}$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-175	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2NH_2}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-176	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-177	$CMe_2CH_2SO_2NMe_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	151-152
1-178	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-179	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
1-180	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-I·	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	185-186
1-181	$\mathrm{CMe_2CH_2SO_2N}\left(\mathrm{CH_2}\right)_4$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	129-130
1-182	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH=CH ₂	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-183	$CMe_2CH_2SO_2NHCH_2C \equiv CH$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	
1-184	$CMe_2CH_2SO_2NHCH_2Ph$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	152-153
1-185	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHPh	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-186	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NH-2-Py	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Yn	物性 融点℃
1-187	CMe ₂ SO ₂ NH ₂	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-188	CMe ₂ SO ₂ NHMe	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-189	CMe ₂ SO ₂ NMe ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-190	CMe ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Me- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-191	CMe ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-192	$CMe_2(CH_2)_2SO_2NH_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-193	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-194	$CMe_2(CH_2)_2SO_2NMe_2$	·3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-195	CMe ₂ (CH ₂) ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-196	$CMe_2(CH_2)_2SO_2NEt_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF (CF}_3)_2$	
1-197	$CMe_2(CH_2)_3SO_2NH_2$	3-1	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-198	$CMe_2(CH_2)_3SO_2NHMe$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-199	$CMe_2(CH_2)_3SO_2NMe_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-200	CMe ₂ (CH ₂) ₃ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	185-186
1-201	$CMe_2(CH_2)_3 SO_2 NEt_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	142-145
1-202	$CMe_2(CH_2)_4 SO_2 NH_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-203	$\mathrm{CMe_2}\left(\mathrm{CH_2}\right)_4\mathrm{SO_2}$ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-204	$CMe_2(CH_2)_4 SO_2 NMe_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-205	$\mathrm{CMe_2}(\mathrm{CH_2})_4\mathrm{SO_2}\mathrm{NHEt}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}\left(\text{CF}_{3}\right)_{2}$	
1-206	$CMe_2(CH_2)_4 SO_2 NEt_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-207	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	Н	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	120-121
1-208	${\rm CMe_2CH_2SO_2NEt_2}$	Н	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	93-94
1-209	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-F	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-210	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-C1	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-211	$CHMeCH_2SO_2NEt_2$	3-C1	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	103-108
1-212	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	136-138
1-213	CHMeCH ₂ SO ₂ NMe ₂	3-Br	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	107-110
1-214	$CHMeCH_2SO_2NEt_2$	3-Br	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	112-115
1-215	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Pr	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	159-161

N o	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Yn	物性 融点℃
1-216	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-i-Pr	3-Br	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	185-187
1-217	CHMeCH ₂ SO ₂ NH-n-Bu	3-Br	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	179-181
1-218	CHMeCH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-Br	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	139-141
1-219	$CMe_2CH_2SO_2NEt_2$	3-Br	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	169-170
1-220	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3,4-Cl ₂	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-221	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3, 4-Br ₂	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-222	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-C1	$2\text{-Me-}4\text{-CF(CF}_3)_2$	
1-223	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-Br	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-224	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	4-I	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-225	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	$3-NO_2$	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-226	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	$3-NH_2$	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-227	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	$3-N\left(\mathrm{CH_3}\right)_2$	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-228	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-NHCOCH ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-229	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-NHCOCF ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-230	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3 -NHSO $_2$ CH $_3$	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-231	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	$3\text{-NHSO}_2\text{CF}_3$	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-232	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-CH ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-233	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-CF ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-234	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-0CH ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	
1-235	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-0CF ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-236	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-0C0CH ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	
1-237	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-0C0CF ₃	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-238	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-SCH ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-239	$\mathtt{CHMeCH_2SO_2NHEt}$	3-SOCH ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-240	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	$3-S0_2CH_3$	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF (CF}_3)_2$	
1-241	$CHMeCH_2SO_2NHEt$	3-SCF_3	$2\text{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-242	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2NHEt}$	3-SOCF ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}\left(ext{CF}_3 ight)_2$	
1-243	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-S0 ₂ CF ₃	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
1-244	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-0S0 ₂ CH ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-245	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-0S0 ₂ CF ₃	2-Me-4-CF(CF ₃) ₂	
1-246	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-C≡CH	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-247	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-C≡CCF ₃	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-248	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-CN	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-249	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3- CHCHCHCH-4	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-250	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-0CF ₂ 0-4	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-251	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3- 0CF ₂ CF ₂ 0-4	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
1-252	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-I	2-Me-4-F	
1-253	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-C1	
1-254	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-Br	
1-255	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-I	
1-256	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-I	2-Me-3-F-4-C1	
1-257	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-C1-4-F	
1-258	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}3$, 4-Cl_2	
1-259	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-C1-4-Br	
1-260	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-3-C1-4-I	
l-261	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2,4-Cl ₂	
l-262	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Cl-4-Br	
1-263	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-I	
1-264	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 4-Br ₂	
1-265	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Br-4-I	
1-266	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3, 4-Cl ₃	アモルファ
1-267	$\mathtt{CHMeCH_2SO_2NEt_2}$	3-I	2, 3, 4-Cl ₃	114-11
1-268	$CMe_2CH_2SO_2NEt_2$	3-I	2, 3, 4-Cl ₃	164-16
1-269	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-Cl ₂ -4-F	
1-270	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-Cl ₂ -4-Br	
1-271	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-Cl ₂ -4-I	
1-272	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-I	2, 4-Cl ₂ -3-Br	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
1-273	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 4-Cl ₂ -3-F	
1-274	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCHF ₂	
1-275	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-1	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	181-182
1-276	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2NEt_2}$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	アモルファス
1-277	$CMe_2CH_2SO_2NEt_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_3$	アモルファス
1-278	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_2\text{CF}_3$	
1-279	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-4-OCF}_2\text{CHF}_2$	
1-280	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-OCF}_2\text{CHFCF}_3$	
1-281	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOCF ₃	
1-282	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -r	ı
1-283	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-OCHF ₂	
1-284	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-0CF ₃	
1-285	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-C1-4-0CF ₃	100-103
1-286	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	2-C1-4-OCF ₃	141-142
1-287	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{C1}4\text{OCF2CF}_3$	
1-288	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-C1-4-OCF}_2\text{CHF}_2$	
1-289	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{C1}4\text{OCF}_2\text{CHFCF}_3$	
1-290	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{C1}4\text{OCF}_2\text{CHFOCF}_3$	
1-291	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-OCF ₂ CHFOC ₃ F ₇ -	n
1-292	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-Cl ₂ -4-0CF ₃	
1-293	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-C1 ₂ -4-OCF ₂ CHF ₂	
1-294	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-C1 ₂ -4-OCF ₂ CHFCF ₃	
1-295	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2, 3-C1 ₂ -4-OCF ₂ CHFOCF	3
1-296	CUM-CU SO NUE+	3-I	2, 3-Cl ₂ -4-	
1 200	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	0 1	$OCF_2CHFOC_3F_7$ -n	
1-297	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-1	$4\text{-}CF_2CF_2CF_3$	
1-298	${\it CHMeCH}_2{\it SO}_2{\it NHEt}$	3-I	4 -CF (CF $_3$) $_2$	
1-299	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF ₃	

		43		
N o	-A-SO ₂ NR ¹ R ²	X _m	Yn	物性 融点℃
1-300	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	
1-301	CHMeCH ₂ SO ₂ NEt ₂	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	118-120
1-302	CMe2CH2SO2NEt2	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF}_2 ext{CF}_3$	アモルファス
1-303	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ Ph	3-1	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	153-154
1-304	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SMe	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	164-166
1-305	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SOMe	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	150-152
1-306	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	139-142
1-307	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	159-160
1-308	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SOEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CF}_2\text{CF}_3$	198-199
1-309	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	133-134
1-310	CMe ₂ CH ₂ SO ₂ NHCH ₂ CH ₂ SPh	3-I	2-Me-4-CF ₂ CF ₃	144-145
1-311	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-1	2-Me-4-CF ₂ CF ₂ CF ₃	
1-312	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-CF ₃	
1-313	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-F-4-CF ₂ CF ₃	
1-314	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-C1-4-CF ₂ CF ₃	
1-315	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{C1}4\text{CF}_2\text{CF}_2\text{CF}_3$	
1-316	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -F- 4 -CF (CF $_3$) $_2$	
1-317	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -C1-4-CF(CF $_3$) $_2$	
1-318	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Br-}4\text{-CF}\left(\text{CF}_{3}\right)_{2}$	
1-319	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -I-4-CF(CF $_3$) $_2$	
1-320	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Et-4-CF(CF}_3)_2$	
1-321	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-n-Pr-4-CF(CF ₃) ₂	
1-322	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -i-Pr-4-CF(CF $_3$) $_2$	
1-323	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -t-Bu-4-CF(CF $_3$) $_2$	
1-324	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 –Ph–4–CF (CF $_3$) $_2$	
1-325	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -CH $_2$ OH- 4 -CF (CF $_3$) $_2$	
1-326	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-CH}_2\text{OMe-4-CF}\left(\text{CF}_3\right)_2$	
1-327	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -OMe-4-CF(CF $_3$) $_2$	
1-328	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SMe-4-CF(CF ₃) ₂	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Yn	物性 融点℃
1-329	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-N (Me) ₂ -4-CF (CF ₃) ₂	
1-330	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-NO ₂ -4-CF (CF ₃) ₂	·
1-331	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-CF ₃ -4-CF(CF ₃) ₂	
1-332	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 –CHO–4–CF (CF $_3$) $_2$	
1-333	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -CN- 4 -CF (CF $_3$) $_2$	
1-334	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-COMe-4-CF(CF}_3)_2$,
1-335	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2, 3-(Me)_2-4-CF(CF_3)_2$	
1-336	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Me- 3 -F- 4 -CF(CF $_3$) $_2$,
1-337	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me}3 ext{-}C1 ext{-}4 ext{-}CF(CF_3)_2$	
1-338	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}3\text{-}0\text{H-}4\text{-}CF(CF_3)_2$	
1-339	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-}3 ext{-CMe-}4 ext{-CF}(CF_y)_2$	
1-340	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Me- 5 -F- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-341	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Me- 5 -Cl- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
1-342	$CHMeCH_2SO_2NH_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CH(CF}_3)_2$	214-216
1-343	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-4-CH(CF}_3)_2$	232-234
1-344	$CMe_2CH_2SO_2NEt_2$	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-CH(CF}_3)_2$	アモルファス
1-345	$CMe_2CH_2SO_2N\left(CH_2\right)_4$	3-I	$2\text{-Me-4-CH(CF}_3)_2$	アモルファス
1-346	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-C}$ (OH) (CF $_3$) $_2$	
1-347	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-C}(OMe)(CF_3)_2$	
1-348	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-Me-}4\text{-C}(0\text{Et})(\text{CF}_3)_2$	
1-349	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-0CF ₂ 0-3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-350	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-00H ₂ 0-3-4-CF(CF ₃) ₂	
1-351	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2-(CH_2)_3-3-4-CF(CF_3)_2$	
1-352	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2-(CH_2)_4-3-4-CF(CF_3)_2$	
1-353	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-Me-4-CF(CF ₃)CF ₂ CF ₃	

$$X_{m} \xrightarrow{3} O \xrightarrow{A-SO_{2}-N} R^{1}$$

$$X_{m} \xrightarrow{4} O \xrightarrow{N} R^{2}$$

$$X_{m} \xrightarrow{5} Y_{n}$$

$$X_{m} \xrightarrow{6} \xrightarrow{5} Y_{n}$$

$$X_{m} \xrightarrow{6} O \xrightarrow{N} A^{2}$$

第2表

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y _n	物性 融点℃
2-1	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4-CF (CF ₃) ₂	
2-2	$CHMeCH_2SO_2NH_2$	3-I	$2 ext{-Me} ext{-}4 ext{-}CF\left(\text{CF}_{3} ight)_{2}$	
2-3	CHMeCH ₂ SO ₂ NHMe	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	
2-4	$\mathrm{CHMeCH_2SO_2NMe_2}$	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
2-5	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
2-6	$CHMeCH_2SO_2NEt_2$	3-I	$2 extsf{-Me-4-CF(CF}_3)_2$	
2-7	$CMe_2CH_2SO_2NEt_2$	3-I	$2 ext{-Me-}4 ext{-CF(CF}_3)_2$	アモルファス
2-8	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -C1-4-CF(CF $_3$) $_2$	
2-9	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-}0\text{Me-}4\text{-}\text{CF(CF}_3)_2$	
2-10	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-SMe-4-CF(CF}_3)_2$	
2-11	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -SOMe- 4 -CF(CF $_3$) $_2$	
2-12	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-SO}_2\text{Me-4-CF(CF}_3)_2$	
2-13	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Et-4-CF(CF $_3$) $_2$	
2-14	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2-n-Pr-4-CF(CF_3)_2$	
2-15	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	4 -CH(CF $_3$) $_2$	
2-16	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2 ext{-Me-4-CH(CF}_3)_2$	アモルファン
2-17	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -C1-4-CH(CF $_3$) $_2$	
2-18	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2\text{-OMe-}4\text{-CH(CF}_3)_2$	
2-19	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	$2-SMe-4-CH(CF_3)_2$	
2-20	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SOMe-4-CH(CF ₃) ₂	
2-21	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2-SO ₂ Me-4-CH(CF ₃) ₂	
2-22	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -Et- 4 -CH(CF $_3$) $_2$	

Νο	$-A-SO_2NR^1R^2$	X _m	Y"	物性 融点℃
2-23	CHMeCH ₂ SO ₂ NHEt	3-I	2 -n-Pr-4-CH(CF $_3$) $_2$	

第1表及び第2表中、物性がアモルファスで示される化合物の 1 H-NMRデータを第3表に示す。

第3表

	NMRデータ
No.	¹ H-NMR[CDC1 ₃ (or DMSO-d ₆)/TMS, δ値(ppm)]
1-62 (CDC1 ₃)	1. 30(d, 3H), 1. 60(s, 6H), 2. 38(s, 3H), 2. 80(m, 2H), 3. 30(m, 3H), 3. 43(s, 2H), 4. 00(m, 1H), 4. 50(m, 1H), 6. 45(br, 1H), 7. 25(m, 1H), 7. 48(m, 2H), 7. 76(d, 1H), 7. 98(d, 1H), 8. 29(d, 1H), 8. 40(br, 1H)
1-147 (CDCl ₃)	1. 09 (d, 3H), 1. 44 (d, 3H), 2. 05 (s, 3H), 2. 37 (s, 3H), 2. 43 (m, 2H), 3. 32 (m, 2H), 3. 63 (m, 1H), 4. 63 (m, 1H), 5. 46 (br, 1H), 6. 70 (br, 1H), 7. 21 (t, 1H), 7. 36 (d, 1H), 7. 44 (s, 1H), 7. 70 (d, 1H), 7. 90 (m, 2H), 8. 64 (br, 1H)
1-149 (CDCl ₃)	1. 19(d, 3H), 1. 37(d, 3H), 2. 33(s, 3H), 2. 83(s, 3H), 3. 52(m, 2H), 3. 27(d, 2H), 3. 98(m, 1H), 4. 55(m, 1H), 5. 98(br, 1H), 6. 88(br, 1H), 7. 11(t, 1H), 7. 33(d, 1H), 7. 42(s, 1H), 7. 60(m, 1H), 7. 83(m, 2H), 8. 89(br, 1H)
1-175 (DMSO-d ₆)	1. 49(s, 6H), 2. 35(s, 3H), 3. 65(s, 2H), 6. 91(br, 2H), 7. 25(m, 1H), 7. 51(d, 1H), 7. 52(s, 1H), 7. 70(d, 1H), 7. 78(d, 1H), 7. 99(d, 1H), 8. 29(s, 1H), 9. 87(br, 1H)
1-176 (CDCl ₃)	1.63(s,6H), 2.39(s,3H), 2.56(d,3H), 3.41(s,2H), 4.21(br,1H), 6.48(br,1H), 7.20(m,1H), 7.47(m,2H), 7.74(d,1H), 7.99(d,1H), 8.30(br,1H), 8.32(d,1H)
1-178 (CDC1 ₃)	1.01(t, 3H), 1.61(s, 6H), 2.38(s, 3H), 2.98(q, 2H), 3.40(s, 2H), 4.52(br, 1H), 6.63(br, 1H), 7.19(m, 1H), 7.43(m, 2H), 7.71(d, 1H), 7.95(d, 1H), 8.21(d, 1H), 8.46(br, 1H)
1-179 (CDC1 ₃)	1.08(t,6H),1.61(s,6H),2.34(s,3H),3.12(q,4H),3.21(s,2H),6.75(br,1H),7.20(m,1H),7.43(m,2H),7.75(d,1H),7.96(d,1H),8.37(d,1H),8.50(br,1H)
1-266 (DMSO-d ₆)	1.00(t, 3H), 1.28(d, 3H), 2.84(m, 4H), 4.27(m, 1H), 7.14(br, 1H), 7.28(m, 1H), 7.67(m, 3H), 8.03(d, 1H), 8.52(d, 1H), 10.14(br, 1H)

1-276 (CDCl ₃)	1.10(t,6H), 1.46(d,3H), 2.31(s,3H), 3.15(m,5H), 3.67(m,1H), 4.60(m,1H), 6.80(br,1H), 7.04(s,1H), 7.21(t,1H), 7.25(d,1H), 7.74(d,1H), 7.95(d,1H), 8.01(d,1H), 8.26(br,1H)
1-277 (CDC1 ₃)	1. 11 (t, 6H), 1. 63 (s, 6H), 2. 33 (s, 3H), 3. 14 (q, 4H), 3. 20 (s, 2H), 6. 67 (br, 1H), 7. 12 (d, 1H), 7. 21 (m, 2H), 7. 77 (d, 1H), 7. 97 (d, 1H), 8. 18 (d, 1H), 8. 30 (br, 1H)
1-302 (CDC1 ₃)	1. 10(t, 6H), 1. 62(s, 6H), 2. 38(s, 3H), 3. 12(q, 4H), 3. 16(s, 2H), 6. 68(br, 1H), 7. 22(m, 1H), 7. 43(m, 2H), 7. 79(d, 1H), 7. 99(d, 1H), 8. 43(br, 1H), 8. 45(d, 1H)
1-344 (CDC1 ₃)	1.09(t,6H), 1.62(s,6H), 2.35(s,3H), 3.13(q,4H), 3.20(s,2H), 3.99(m,1H), 6.63(br,1H), 7.26(m,3H), 7.78(d,1H), 7.98(d,1H), 8.33(d,1H), 8.35(br,1H)
1-345 (CDC1 ₃)	1.63(s,6H), 1.78(m,4H), 2.35(s,3H), 3.19(m,4H), 3.26(s,2H), 3.99(m,1H), 6.68(br,1H), 7.23(m,3H), 7.77(d,1H), 7.98(d,1H), 8.31(d,1H), 8.33(br,1H)
2-5 (CDCl ₃)	1. 05(t, 3H), 1. 47(d, 3H), 2. 59(s, 3H), 3. 05(m, 2H), 3. 25(d, 2H), 4. 50(m, 1H), 5. 05(br, 1H), 6. 65(br, 1H), 7. 25(m, 1H), 7. 45(d, 1H), 7. 73(d, 1H), 7. 97(d, 1H)8. 33(d, 1H), 8. 63(br, 1H)
2-7 (CDCl ₃)	1.08(t,6H),1.63(s,6H),2.62(s,3H),3.12(q,4H),3.18(s,2H),6.79(br,1H),7.22(m,1H),7.53(d,1H),7.77(d,1H),7.98(d,1H),8.73(d,1H),8.78(br,1H)
2-16 (CDCl ₃)	1.01(t, 3H), 1.46(d, 3H), 2.55(s, 3H), 3.03(m, 2H), 3.24(d, 2H), 4.40(m, 2H), 5.10(br, 1H), 6.65(br, 1H), 7.25(m, 2H), 7.71(d, 1H), 7.93(d, 1H), 8.14(d, 1H), 8.74(br, 1H)

実施例

以下に本発明の代表的な実施例を例示するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

5 実施例1.

 N^2 - (2-xチルスルファモイル-1-xチルエチル)-3-3-ド- N^1 - $\{2-x$ チル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル $\}$ フタルアミド (化合物No. 1-4) の製造 (1-1) . 2-アミノプロパノール2 2 . 5 3 g (3 0 0 mm o 1) をテトラ ヒドロフラン (5 0 0 ml 1) に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの 3 0 %トルエン溶液 1 5 5 . 1 g (3 0 0 mm o 1) 、トリエチルアミン 3 6 . 4 3

25

g (360mmol)のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。 室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸 エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後、希塩酸を加え、酢酸エチルで3回抽 出した。有機層を飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄し、無水硫酸ナトリウムで 5 乾燥後、溶媒を留去して(2-ヒドロキシー1-メチルエチル)カルバミン酸ベンジルを49.8g (収率79%)得た。

(1-2). (2-ヒドロキシ-1-メチルエチル)カルバミン酸ベンジル46. 5g(222mmol)、トリエチルアミン26.96g(266mmol)をテトラヒドロフラン(400ml)に溶かし、0℃でメタンスルホニルクロリド 27.96g(244mmol)のテトラヒドロフラン溶液をゆっくりと滴下した。室温で5時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した後、水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で2回洗浄して、メタンスルホン酸2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルを49.5g(収率78%)得た。

(1-3). メタンスルホン酸 2- (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル 34.9g (120mmol) をエタノール (120ml) に溶かし、チオグリコール酸 14.42g (120mmol) とナトリウムエトキシド (120

- 20 mmol)のエタノール溶液から別途調製したチオラートを滴下した。室温で30分間、50℃で2時間反応後、溶媒を留去し、残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出し、飽和重曹水、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミ
- (1-4). 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルチオ酢酸34. 5g(110mmol)を酢酸エチル(150ml)に溶かし、0℃でメタクロロ過安息香酸23.9g(110mmol)の酢酸エチル溶液(50ml)をゆっくりと滴下した。室温で3時間反応後、反応溶液を飽和重曹水中に注ぎ、酢酸

ノ)プロピルチオ酢酸を34.5g(収率92%)得た。

エチルで抽出、飽和重曹水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒(ヘキサン:酢酸エチル=2: 1)で2回洗浄して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルスルフ

5 (1-5). 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピルスルフィニル酢酸30.38g(93mmol)をメタノール(300ml)に懸濁させ、ヨウ素19.04g(75mmol)を加え、還流下5時間反応させた。反応混合物に亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて、過剰のヨウ素を還元した後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、メタノールを留去した。残渣に水を加え

ィニル酢酸を30.38g(収率84%)得た。

10 て酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。 溶媒を留去して得た粗製のビス [2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロピル]ジスルフィド(29mmol、1H-NMR積分比より概算)をエタノール(150ml)に懸濁させ、N-ブロモコハク酸イミド15.66g(88mmol)を少量ずつ加えた。室温で3時間反応後、飽和重曹水と重曹を加えて溶液を弱塩基性とし、エタノールを留去した。残渣に水を加えて酢酸エチルで3回抽出、水で3回、飽和食塩水で順次洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で精製して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルフィン酸エチルを16.0g(収率60%)得た。

20 (1-6). 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルフィン酸エチル2.2g(7.4mmol)をエタノール(7ml)に溶かし、氷冷下10%水酸化ナトリウム水溶液3.2g(8mmol)をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水を加えてメチルターシャリーブチルエーテルで2回抽出し、水層を濃塩酸で酸性として、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で2回洗浄して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルフィン酸を1.73g(収率91%)得た。

(1-7). 炭酸カリウム 0.52g (3.8 mm o 1)を水 (10 m 1) に溶か

し、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルフィン酸1. 73g(6.7mmol)を加えた後、臭素1.07g(6.7mmol)を滴下した(滴下途中での結晶が析出して攪拌が困難になってくるため、適宜水を加えた)。室温で30分間攪拌後、結晶を濾過し、水で洗浄して、2-(ベンジルオ5 キシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルホニルブロミドを2.30g(定量的)得た。

(1-8).70%エチルアミン水溶液(10ml)に氷冷下、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルホニルブロミド1.44g(3.3 mmol)のテトラヒドロフラン溶液(5ml)を滴下した。室温で1時間反応させた後、反応混合物を希塩酸中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製のN-エチルー2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルホンアミドをそのまま次の反応に用いた。

(1-9).10%Pd-C 0.07gをアルゴン置換した加圧水添用ボトルに入れ、エタノール(10ml)を一気に加えて懸濁させた後、(1-8)で得た粗製のN-エチルー2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパンー1ースルホンアミドのエタノール溶液(20ml)を加えて、加圧下(水素圧4Kg/cm²)10時間反応させた(途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した)。反応溶液をセライト濾過、エタノールで洗浄し、濾20液を減圧濃縮して得た結晶を溶媒(ヘキサン:酢酸エチル=2:1)で2回洗浄して、N-エチルー2-アミノプロパン-1-スルホンアミドを0.27g{2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)プロパン-1-スルホニルブロミドから収率50%}得た。

(1-10).3-ヨード無水フタル酸5.5g(20mmol)をアセトニトリル(100ml)に溶かし、2-メチルー4ー[1,2,2,2ーテトラフルオロー1ー(トリフルオロメチル)エチル]アニリン5.5g(20mmol)のアセトニトリル溶液(20ml)をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、減圧下にアセトニトリルの2/3量を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄し、6-ヨード-N-{2-メチルー4-[1,2,2,2ーテトラファーター

ルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル) フタルアミド酸を5. 6 g (収率51%) 得た。

(1-11). 6-ヨードーN- {2-メチルー4- [1,2,2,2-テトラフルオロ-1- (トリフルオロメチル) エチル] フェニル} フタルアミド酸5.4
5 7g (10mmol)をメチルターシャリープチルエーテル (60ml) に懸濁させ、無水トリフルオロ酢酸3.15g (15mmol)のメチルターシャリープチルエーテル溶液をゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、氷水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水で2回、飽和食塩水で1回洗浄後、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗結晶を溶媒 (ヘキサン:酢酸エチル・4-1)で2回洗浄して、1,3-ジヒドロー7-ヨードー3-{2-メチルー4-[1,2,2,2-テトラフルオロー1-(トリフルオロメチル) エチル]フェニルイミノ}ー2ーベンゾフランー1ーオンを5.0g (収率94%)得た。

(1-12). 1. $3-\tilde{y}$ \vdash \tilde{y} $=7-3-\tilde{y}$ - $-3-\{2-\tilde{y}$ --4-[1,

- 15 2,2,2ーテトラフルオロー1ー(トリフルオロメチル)エチル]フェニルイミノ}ー2ーベンゾフランー1ーオン0.42g(0.8mmol)をアセトニトリル(10ml)に溶かし、(1-9)で得たNーエチルー2ーアミノプロパンー1ースルホンアミド0.13g(0.8mmol)を加え、室温で10時間反応させた。溶媒を留去し、析出した結晶を濾過、アセトニトリルで洗浄後、混合溶媒
- 20 (ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で更に洗浄し、 N^2 -(2-エチルスルファモイルー1-メチルエチル)-3-ヨードー N^1 $\{2$ -メチルー4- [1,2,2,2-テトラフルオロー1- (トリフルオロメチル)エチル]フェニル $\{1,2,2,2$ -テトラフルオロー $\{1,2,2,2\}$ -アミドを $\{1,2,2\}$ -ルアミドを $\{1,2\}$ -ルアミドアシア・ $\{1,2\}$ -ルアミドアシア・ $\{1,2\}$ -ルアミドアシア・ $\{1,2\}$ -ルアミドアシア・ $\{1,2\}$ -ルアミア・ $\{1,2\}$ -ルア・ $\{1,2$

融点:170~172℃

25 実施例2.

 $3-3-ド-N^1-\{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ-1-(トリフルオロメチル) エチル] フェニル<math>\}-N^2-(2-スルファモイル-1,1-ジメチルエチル)$ フタルアミド (化合物 $No.\ 1-175$) の製造 $(2-1).\ 1,1-ジメチル-2-(メチルチオ)$ エチルアミン 23.86g

(200mmol)をテトラヒドロフラン (300ml)に溶かし、氷冷下、カルボベンゾキシクロリドの30%トルエン溶液103.4g (200mmol)、トリエチルアミン24.29g (240mmol)のテトラヒドロフラン溶液を順次、ゆっくりと滴下した。室温で3時間攪拌後、析出してきたトリエチルアミンの塩酸塩を減圧濾過、酢酸エチルで洗浄した。濾液を減圧濃縮した残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製して、1,1ージメチルー2ー(メチルチオ)エチルカルバミン酸ベンジルを36.35g (収率72%) 得た。

(2-2). 1,1-ジメチル-2-(メチルチオ) エチルカルバミン酸ベンジ 10 ル 4 5. 4 g (1 7 9 mm o l) の含水メタノール溶液(メタノール 1 5 0 m l に水 5.22g (290mmol) を加えたもの) に攪拌しながらNープロモコ ハク酸イミド33.46g(188mmol)を少量ずつ加えた。室温で2時間 反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノールを留去した。残 渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で3回、飽和食塩水で1回洗浄し、 15 無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の1,1ージメチルー 2-(メチルスルフィニル)エチルカルバミン酸ベンジルを無水酢酸(150 m 1) に溶かし、還流下 4 時間反応させた。過剰の無水酢酸および酢酸を減圧下 に留去し、粗製の酢酸[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチル プロピル]チオメチルを含有する残渣を得た。この残渣をメタノール(300 20 ml) に溶かし、ヨウ素19.54g (77mmol) を加え、還流下5時間反 応させた。反応混合物を室温まで冷却後、亜硫酸水素ナトリウム水溶液を加えて 過剰のヨウ素を還元し、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とした後、メタノール を留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出、飽和食塩水で洗浄、無水 硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルのカラムクロ

25 マトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=4:1)で精製して、ビス[2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロピル]ジスルフィドを10.0g(収率23%)得た。

(2-3). ビス [2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ) - 2-メチルプロピル] ジスルフィド<math>10.0g(21mmol)をエタノール (150ml) に

溶かし、N-ブロモコハク酸イミド11.21g(63mmol)を攪拌しなが ら少量ずつ加えた。室温で2時間反応後、飽和重曹水で反応溶液を弱塩基性とし た後、エタノールを留去した。残渣に水を加え、酢酸エチルで3回抽出し、水で 3回、飽和食塩水で1回洗浄し、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去し て得た残渣をシリカゲルのカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル= 2:1)で精製して、2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルフィン酸エチルを10.45g(収率83%)得た。

(2-4). 2-(ベンジルオキシカルボニルアミノ) <math>-2-メチルプロパンー 1-スルフィン酸エチル0.60g(2mmol)をエタノール(10ml) に

10 溶かし、氷冷下10%水酸化ナトリウム水溶液0.9g(2.2mmol)をゆっくりと滴下した。室温で1時間反応後、エタノールを留去し、残渣に水(10ml)、酢酸ナトリウム0.18g(2.2mmol)、ヒドロキシルアミンーOースルホン酸0.25g(2.2mmol)を加え、室温で1時間反応させた。反応混合物を水中に注ぎ、酢酸エチルで3回抽出、飽和重曹水、飽和食塩水で順次 洗浄、無水硫酸ナトリウムで乾燥した。溶媒を留去して得た粗製の2ー(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ー2ーメチルプロパン-1ースルホンアミド0.4

9g(収率86%)をそのまま次の反応に用いた。

25 まま次の反応に用いた。

(2-5). 10%Pd-C 0.20gをアルゴン置換した加圧水添用ボトル に入れ酢酸(<math>5m1)を一気に加えて懸濁させた後、(2-4)で得た2-(べ 20 ンジルオキシカルボニルアミノ)-2-メチルプロパン-1-スルホンアミドの 酢酸溶液(10m1)を加えて、加圧下(水素圧 $4Kg/cm^2$)10時間反応 させた(途中、発生する一酸化炭素の分圧を下げるため、圧を下げ、再び加圧した)。反応溶液をセライト濾過、エタノール洗浄し、濾液を減圧濃縮した残渣 (粗製の<math>2-アミノ-2-メチルプロパン-1-スルホンアミド酢酸塩)をその

(2-6). 1, 3-ジヒドロ-7-3ード $-3-\{2-メチル-4-[1,2,2,2-テトラフルオロ<math>-1$ -(トリフルオロメチル) エチル] フェニルイミ (1) (1) (2) (2) (3) (3) (3) (3) (3) (3) (3) (3) (3) (4)

ンスルホンアミド酢酸塩及びトリエチルアミン0.17g (1.7mmo1)を加えて、室温で30時間反応させた。溶媒を留去して得た残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(ヘキサン:酢酸エチル=1:1)で精製して、3-3=ドー $N^{1}-\{2-3$ +ルー4-[1,2,2,2-7+ラフルオロー1-(+リフルオロメチル)エチル〕フェニル $\}-N^{2}-(2-3$ ルファモイルー1,1-3+チルエチル)フタルアミドをアモルファスとして0.05g (収率9%) 得た。

¹H-NMR [DMSO-d₆/TMS, δ値(ppm)]

- 1. 49 (s, 6H), 2. 35 (s, 3H), 3. 65 (s, 2H), 6. 91 (br, 2H), 7. 25 (m, 1H), 7. 51 (d, 1H), 7. 52 (s, 1H), 7. 70 (d, 1H), 7. 78 (d, 1H), 7. 99 (d, 1H), 8. 29 (s, 1H), 9. 87 (br, 1H)
- 10 本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分として含有する農園芸用殺虫剤は水稲、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等を加害する各種農林、園芸、貯穀害虫や衛生害虫或いは線虫等の害虫防除に適しており、例えばリンゴコカクモンハマキ(Adoxophyes orana fasciata)、チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)、リンゴコシンクイ(Grapholita
- 15 inopinata)、ナシヒメシンクイ (Grapholita molesta)、マメシンクイガ (Leguminivora glycinivorella)、クワハマキ (Olethreutes mori) チャノホ ソガ (Caloptilia thevivora)、リンゴホソガ (Caloptilia zachrysa)、キンモンホソガ (Phyllonorycter ringoniella)、ナシホソガ (Spulerrina astaurota)、モンシロチョウ (Piers rapae crucivora)、オオタバコガ類
- 20 (Heliothis sp.)、コドリンガ (Laspey resia pomonella)、コナガ (Plutella xylostella)、リンゴヒメシンクイ (Argyresthia conjugella)、モモシンクイガ (Carposina niponensis)、ニカメイガ (Chilo suppressalis)、コプノメイガ (Cnaphalocrocis medinalis)、チャマダラメイガ (Ephestia elutella)、クワノメイガ (Glyphodes pyloalis)、サンカメイガ
- 25 (Scirpophaga incertulas)、イチモンジセセリ (Parnara guttata)、アワヨトウ (Pseudaletia separata)、イネヨトウ (Sesamia inferens)、ハスモンヨトウ (Spodoptera litura)、シロイチモジョトウ (Spodoptera exigua) 等の鱗翅目害虫、フタテンヨコバイ (Macrosteles fascifrons)、ツマグロヨコバイ (Nephotettix cincticeps)、トビイロウンカ (Nilaparvata lugens)、セジロ

ウンカ (Sogatella furcifera) 、ミカンキジラミ (Diaphorina citri) 、ブド ウコナジラミ (Aleurolobus taonabae) 、タバココナジラミ (Bemisia tabaci) 、 オンシツコナジラミ (Trialeurodes vaporariorum) 、ニセダイコンアブラムシ (Lipaphis erysimi) 、モモアカアブラムシ (Myzus persicae) 、ツノロウムシ 5 (Ceroplastes ceriferus)、ミカンワタカイガラムシ (Pulvinaria aurantii)、 ミカンマルカイガラムシ(Pseudaonidia duplex)、ナシマルカイガラムシ (Comstockaspis perniciosa)、ヤノネカイガラムシ (Unaspis yanonensis) 等 の半翅目害虫、ヒメコガネ(Anomala rufocuprea)、マメコガネ(Popillia japonica)、タバコシバンムシ (Lasioderma serricorne)、ヒラタキクイムシ 10 (Lyctus brunneus) 、ニジュウヤホシテントウ (Epilachna vigintiotopunctata)、アズキゾウムシ (Callosobruchus chinensis)、ヤサイ ゾウムシ (Listroderes costirostris) 、コクゾウムシ (Sitophilus zeamais) 、 ワタミゾウムシ (Anthonomus grandis grandis) 、イネミズゾウムシ (Lissorhoptrus oryzophilus) 、ウリハムシ (Aulacophora femoralis) 、イネ ドロオイムシ (Oulema oryzae) 、キスジノミハムシ (Phyllotreta striolata) 、 15 マツノキクイムシ(Tomicus piniperda)、コロラドポテトビートル (Leptinotarsa decemlineata)、メキシカンビーンビートル (Epilachna varivestis)、コーンルートワーム類(Diabrotica sp.)等の甲虫目害虫、ウリ ミバエ (Dacus (Zeugodacus) cucurbitae) 、ミカンコミバエ (Dacus (Bactrocera) dorsalis) 、イネハモグリバエ (Agromyza oryzae) 、タマネギ 20 バエ (Delia antiqua) 、タネバエ (Delia platura) 、ダイズサヤタマバエ (Asphondylia sp.)、イエバエ (Musca domestica)、アカイエカ (Culex pipiens pipiens) 等の双翅目害虫、ネグサレセンチュウ (Pratylenchus sp.)、 ミナミネグサレセンチュウ(Pratylenchus coffeae)、ジャガイモシストセンチ ュウ (Globodera rostochiensis)、ネコブセンチュウ (Meloidogyne sp.)、ミ 25 カンネセンチュウ (Tylenchulus semipenetrans) 、ニセネグサレセンチュウ (Aphelenchus avenae) 、ハガレセンチュウ (Aphelenchoides ritzemabosi) 等 のハリセンチュウ目害虫、ミカンハダニ (Panonychus citri)、リンゴハダニ (Panonychus ulmi)、ニセナミハダニ (Tetranychus cinnabarinus)、カンザ

ワハダニ (Tetranychus kanzawai Kishida)、ナミハダニ (Tetranychus urticae Koch)、チャノナガサビダニ (Acaphylla theae)、ミカンサビダニ (Aculops pelekassi)、チャノサビダニ (Calacarus carinatus)、ナシサビダニ (Epitrimerus pyri)等のダニ目害虫等に対して強い殺虫効果を有するもの である。

本発明の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類を有効成分とする農園芸用殺虫剤は、水田作物、畑作物、果樹、野菜、その他の作物及び花卉等に被害を与える前記害虫に対して顕著な防除効果を有するものであるので、害虫の発生が予測される時期に合わせて、害虫の発生前又は発生が確認された時点で水田、畑、果樹、野菜、その他の作物、花卉等の種子、水田水、茎葉又は土壌に処理することにより本発明の農園芸用殺虫剤の所期の効果が奏せられるものである。

本発明の農園芸用殺虫剤は、農薬製剤上の常法に従い、使用上都合の良い形状に製剤して使用するのが一般的である。

- 15 即ち、一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類はこれらを 適当な不活性担体に、又は必要に応じて補助剤と一緒に適当な割合に配合して溶 解、分離、懸濁、混合、含浸、吸着若しくは付着させ、適宜の剤形、例えば懸濁 剤、乳剤、液剤、水和剤、粒剤、粉剤、錠剤、パック剤等に製剤して使用すれば 良い。
- 20 本発明で使用できる不活性担体としては固体又は液体の何れであっても良く、 固体の担体になりうる材料としては、例えばダイズ粉、穀物粉、木粉、樹皮粉、 鋸粉、タバコ茎粉、クルミ殻粉、ふすま、繊維素粉末、植物エキス抽出後の残渣、 粉砕合成樹脂等の合成重合体、粘土類(例えばカオリン、ベントナイト、酸性白 土等)、タルク類(例えばタルク、ピロフィライト等)、シリカ類(例えば珪藻 25 土、珪砂、雲母、ホワイトカーボン(含水微粉珪素、含水珪酸ともいわれる合成 高分散珪酸で、製品により珪酸カルシウムを主成分として含むものもある。))、 活性炭、イオウ粉末、軽石、焼成珪藻土、レンガ粉砕物、フライアッシュ、砂、 炭酸カルシウム、燐酸カルシウム等の無機鉱物性粉末、ポリエチレン、ポリプロ ピレン、ポリ塩化ビニリデン等のプラスチック担体、硫安、燐安、硝安、尿素、

塩安等の化学肥料、堆肥等を挙げることができ、これらは単独で若しくは二種以上の混合物の形で使用される。

液体の担体になりうる材料としては、それ自体溶媒能を有するものの他、溶媒 能を有さずとも補助剤の助けにより有効成分化合物を分散させうることとなるも 5 のから選択され、例えば代表例として次に挙げる担体を例示できるが、これらは 単独で若しくは2種以上の混合物の形で使用され、例えば水、アルコール類(例 えばメタノール、エタノール、イソプロパノール、ブタノール、エチレングリコ ール等)、ケトン類(例えばアセトン、メチルエチルケトン、メチルイソプチル ケトン、ジイソブチルケトン、シクロヘキサノン等)、エーテル類(例えばエチ 10 ルエーテル、ジオキサン、セロソルブ、ジプロピルエーテル、テトラヒドロフラ ン等)、脂肪族炭化水素類(例えばケロシン、鉱油等)、芳香族炭化水素類(例 えばベンゼン、トルエン、キシレン、ソルベントナフサ、アルキルナフタレン 等)、ハロゲン化炭化水素類(例えばジクロロエタン、クロロホルム、四塩化炭 素、塩素化ベンゼン等)、エステル類(例えば酢酸エチル、ジイソプピルフタレ 15 ート、ジブチルフタレート、ジオクチルフタレート等)、アミド類(例えばジメ チルホルムアミド、ジエチルホルムアミド、ジメチルアセトアミド等)、ニトリ ル類(例えばアセトニトリル等)、ジメチルスルホキシド類等を挙げることがで きる。

他の補助剤としては次に例示する代表的な補助剤をあげることができ、これら 20 の補助剤は目的に応じて使用され、単独で、ある場合は二種以上の補助剤を併用 し、又ある場合には全く補助剤を使用しないことも可能である。

有効成分化合物の乳化、分散、可溶化及び/又は湿潤の目的のために界面活性 剤が使用され、例えばポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレ ンアルキルアリールエーテル、ポリオキシエチレン高級脂肪酸エステル、ポリオ 25 キシエチレン樹脂酸エステル、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、 ポリオキシエチレンソルビタンモノオレエート、アルキルアリールスルホン酸塩、 ナフタレンスルホン酸縮合物、リグニンスルホン酸塩、高級アルコール硫酸エス テル等の界面活性剤を例示することができる。

又、有効成分化合物の分散安定化、粘着及び/又は結合の目的のために、次に

例示する補助剤を使用することもでき、例えばカゼイン、ゼラチン、澱粉、メチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、アラビアゴム、ポリビニルアルコール、松根油、糠油、ベントナイト、リグニンスルホン酸塩等の補助剤を使用することもできる。

5 固体製品の流動性改良のために次に挙げる補助剤を使用することもでき、例え ばワックス、ステアリン酸塩、燐酸アルキルエステル等の補助剤を使用できる。

懸濁性製品の解こう剤として、例えばナフタレンスルホン酸縮合物、縮合燐酸 塩等の補助剤を使用することもできる。

消泡剤としては、例えばシリコーン油等の補助剤を使用することもできる。

10 更に必要に応じて機能性展着剤、ピペロニルブトキサイド等の代謝分解阻害剤 等の活性増強剤、プロピレングリコール等の凍結防止剤、BHT等の酸化防止剤、 紫外線吸収剤等その他の添加剤も加えることが可能である。

本発明の農園芸用殺虫剤は各種害虫を防除するためにそのまま、又は水等で適 宜希釈し、若しくは懸濁させた形で病害防除に有効な量を当該害虫の発生が予測 される作物若しくは発生が好ましくない場所に適用して使用すれば良い。

- 20 本発明の農園芸用殺虫剤の使用量は種々の因子、例えば目的、対象害虫、作物の生育状況、害虫の発生傾向、天候、環境条件、剤型、施用方法、施用場所、施用時期等により変動するが、有効成分化合物として10アール当たり0.001gから10kg、好ましくは0.01gから1kgの範囲から目的に応じて適宜選択すれば良い。
- 25 本発明の農園芸用殺虫剤は、更に防除対象病害虫、防除適期の拡大のため、或いは薬量の低減をはかる目的で他の農園芸用殺虫剤、殺ダニ剤、殺線虫剤、殺菌剤、生物農薬等と混合して使用することも可能であり、又使用場面に応じて除草剤、植物成長調節剤、肥料等と混合して使用することも可能である。

以下に本発明の代表的な製剤例及び試験例を示すが、本発明はこれらに限定さ

れるものではない。

尚、処方例中、部とあるのは重量部を示す。

製剤例1.

第1表又は第2表記載の化合物10部5キシレン70部Nーメチルピロリドン10部ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルと

アルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物 10部

以上を均一に混合溶解して乳剤とする。

10 製剤例2.

第1表又は第2表記載の化合物3部クレー粉末8 2部珪藻土粉末1 5部

以上を均一に混合粉砕して粉剤とする。

15 製剤例3.

第1表又は第2表記載の化合物5部ベントナイトとクレーの混合粉末9 0部リグニンスルホン酸カルシウム5部

以上を均一に混合し、適量の水を加えて混練し、造粒、乾燥して粒剤とする。

20 製剤例4.

第1表又は第2表記載の化合物20部カオリンと合成高分散珪酸の混合物75部ポリオキシエチレンノニルフェニルエーテルとアルキルベンゼンスルホン酸カルシウムとの混合物5部

25 以上を均一に混合粉砕して水和剤とする。

試験例1. コナガ (Plutella xylostella) に対する殺虫試験

ハクサイ実生にコナガの成虫を放飼して産卵させ、放飼2日後に産下卵の付い たハクサイ実生を第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50 ppmに希釈した薬液に約30秒間浸漬し、風乾後に25℃の恒温室に静置した。 薬液浸漬6日後に孵化虫数を調査し、下記の式により死虫率を算出し、下記基準に従って判定を行った。1区10頭3連制

無処理区孵化虫数一処理区孵化虫数

5 補正死虫率(%)=----×100

無処理区孵化虫数

判定基準. A・・・死虫率100%

B・・・死虫率99%~90%

C···死虫率89%~80%

10 D・・・死虫率79%~50%

E・・・死虫率50%以下

上記試験の結果を表4に記す。

試験例2. ハスモンヨトウ (Spodoptera litura) に対する殺虫試験

第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した 15 薬液にキャベツ葉片(品種:四季穫)を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cm のプラスチックシャーレに入れ、ハスモンヨトウ2令幼虫を接種した後、蓋をし て25℃の恒温室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、下記の式により 死虫率を算出し、判定基準は試験例1に従って行った。1区10頭3連制。

20 無処理区生存虫数一処理区生存虫数

補正死虫率(%) =----×100

無処理区生存虫数

上記試験の結果を表4に記す。

試験例3.チャノコカクモンハマキ(Adoxophyes sp.)に対する殺虫試験

25 第1表及び第2表記載の化合物を有効成分とする薬剤を50ppmに希釈した 薬液にチャ葉を約30秒間浸漬し、風乾後に直径9cmのプラスチックシャーレ に入れ、チャノコカクモンハマキ幼虫を接種した後、25℃、湿度70%の恒温 室に静置した。接種8日後に生死虫数を調査し、試験例1の判定基準に従って判 定を行った。1区10頭3連制。

上記試験の結果を表4に記す。

第4表

N o	試験例1	試験例2	試験例3
1-1	А	A	A
1-2	Α	Α	Α
1-3	Α	Α	Α
1-4	Α	Α	Α
1-6	Α	Α	Α
1-7	Α	Α	Α
1-8	Α	Α	A
1-12	Α	Α	Α
1-14	Α	Α	Α
1-20	Α	Α	Α
1-21	Α	Α	Α
1 - 22	Α	Α	Α
1-23	Α	Α	Α
1 - 24	A	Α	Α
1 - 25	Α	Α	Α
1-27	A	Α	Α
1-28	Α	Α	Α
1-29	Α	Α	Α
1-30	Α	Α	Α
1-31	Α	Α	Α
1 - 32	Α	Α	Α
1-35	Α	Α	Α
1-36	Α	A	Α
1 - 37	Α	Α	Α
1-38	Α	Α	Α
1 - 39	Α	. А	Α
1-40	Α	Α	Α

N o	試験例1	試験例2	試験例3
1-41	A	A	А
1 - 42	Α	. A	Α
1-43	Α	Α	A
1-44	Α	A	Α
1-45	Α	Α	Α
1-46	Α	Α	Α
1 - 47	Α	Α	Α
1-48	Α	С	Α
1 - 54	Α	Α	Α
1-55	Α	Α	Α
1-56	Α	Α	Α
1-57	Α	Α	Α
1-58	Α	Α	E
1-59	Α	Α	E
1-60	Α	Α	E
1-61	Α	Α	Α
1-62	Α	Α	Α
1-63	Α	Α	A
1 - 66	, A	Α	Α
1 - 67	Α	E	E
1 - 71	Α	Α	Α
1 - 72	Α	Α	Α
1-73	Α	Α	A
1-75	Α	Α	Α
1-76	Α	Α	Α
1-77	Α	A	Α
1 - 78	Α	E	Α
1-79	Α	Α	Α
1-80	A	A	A

·No	試験例1	試験例2	試験例3
1-81	A	A	A
1-82	Α	Α	Α
1-83	Α	А	Α
1-84	Α	Α	Α
1-85	Α	\mathbf{A}_{\perp}	Α
1-86	Α	Α	Α
1-87	Α	Α	Α
1-88	Α	Α	Α
1-89	Α	Α	Α
1-91	Α	Α	Α
1-92	Α	Α	Α
1 - 93	Α	Α	A
1 - 94	Α	. А	Α
1-103	А	Α	Α
1 - 104	Α	Α	Α
1-105	Α	Α	E
1 - 106	Α	E	E
1 - 107	Α	С	Α
1 - 108	Α	Α	Α
1-109	Α	E	A
1-110	Α	E	E
1-111	Α	E	E
1-112	Α	E	E
1-116	Α	D	Α
1-121	Α	E	E
1-142	Α	Α	Α
1-144	Α .	Α	Α
1-146	Α	Α	Α
1 - 147	Α	Α	Α

. 50			
Νο	試験例1	試験例2	試験例3
1-148	A	A	A
1-149	Α	Α	Α
1 - 175	Α	Α	Α
1-176	Α	Α	Α
1-177	Α	A	A
1-178	A	A	A
1-179	Α	Α	A
1-180	Α	С	A
1-181	Α	Α	A
1 - 184	Α	Α	A
1-200	Α	Α	Α
1-201	Α	Α	A
1 - 207	Α	Α	E
1-208	Α	E	Α
1-211	Α	Α	Α
1-212	Α	Α	Α
1-213	Α	Α	Α
1-214	Α	Α	Α
1-215	Α	Α	Α
1 - 216	Α	Α	Α
1 - 217	Α	Α	Α
1-218	Α	Α	Α
1-219	Α	Α	Α
1 - 266	Α	С	E
1 - 267	Α	С	E
1-268	Α	Α	Α
1-275	Α	E	E
1-276	Α	E	E
1-277	Α	A	Α

WO 2004/018415 PCT/JP2003/010774

51

No	試験例1	試験例2	試験例3
1-285	A	С	В
1-286	Α	А	E
1 - 301	Α	Α	Α
1-302	Α	Α	А
1-303	Α	Α	Α
1 - 304	A	. A	Α
1 - 305	Α	Α	Α
1 - 306	Α	Α	Α
1 - 307	Α	Α	Α
1 - 308	Α	Α	Α
1 - 309	Α	Α	Α
1 - 310	Α	Α	Α
1 - 342	Α	Α	Α
1 - 343	Α	Α	Α
1 - 344	Α	Α	А
1 - 345	Α	Α	А
2-5	Α	Α	Α
2-7	Α	Α	Α
2-16	A	E	Α

52

請求の範囲

1. 一般式(I)

{式中、AはC1-C6アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキル チオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホ ニル基、モノC1-C6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC1-C6ア 10 ルキルアミノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C₁-C₆アルキレン基、 C3-C6アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニ トロ基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハ ロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスル フィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モ ノC1-C6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC1-C6アルキルアミ 15 ノ基から選択される1以上の置換基を有する置換C3-C6アルケニレン基、C3-C6ア ルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト ロ基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフ 20 ィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノ C1-C6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ 基から選択される1以上の置換基を有する置換C3-C6アルキニレン基を示す。又、 C_1 - C_6 アルキレン基、置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、置換 C_3 - C_6 アルケニレン基、C3-C6アルキニレン基又は置換C3-C6アルキニレン基中の任意の 飽和炭素原子はC₂-C₅アルキレン基で置換されてC₃-C₆シクロアルカン環を示すこ

ともでき、 C_2 - C_6 アルキレン基、置換 C_2 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基又は置換 C_3 - C_6 アルケニレン基中の任意の2個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒になって C_3 - C_6 シクロアルカン環又は C_3 - C_6 シクロアルケン環を示すこともできる。

- R^{-1} は水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)ア ミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルキル)アミノカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、フェノ
- 15 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6)

キシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ

 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、

- 20 アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、 (C_1-C_6) アルキルスルホニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルホニル基又は (C_1-C_6) アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な
- 25 っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオールスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカニル

基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置 換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ アノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロC1-C6アルコキシ基、モノC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い 5 ジC₁-C₆アルキルアミノ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキ ルスルホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基又はC1-C6アルコキシカルボニ ル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以 上の置換基を有する置換C1-C6アルキル基、C3-C6アルケニル基、ハロC3-C6アルケ 10 ニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 シクロアルキル基、 水酸基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、アミノ基、モノC1-C6アル キルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良い ジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC₁-C₆アルキル)ア ミノ基、C1-C6アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異な 15 っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆ アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、 ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルス ルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、 モノC1-C6アルキルアミノ基、モノ(ハロC1-C6アルキル)アミノ基、同一又は異 20 なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC₁-C₆ アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカ ルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、 ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト ロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6 アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキル 25 スルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル 基、ハロC1-C6アルキルスルホニル基、モノC1-C6アルキルアミノ基、モノ(ハロ C1-C6アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、 同一又は異なっても良いジ (ハロC1-C6アルキル) アミノ基、C1-C6アルコキシカ

ルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換 基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、-N=C(T^1) T^2 (式中、 T^1 及 び T^2 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、

- 5 =トロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミ
- 10 ノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)、フェニル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ
- 15 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボ
- 25 キルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示す。

 R^2 、 R^3 及び R^4 は同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 -

 C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_4 アルコキシ C_1 - C_4 アルキル基又は C_1 - C_4 アルキルチオ C_1 - C_4 アルキル基を示す。又、 R^2 はA又は R^1 と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されて も良い3~8員環を形成することができ、該3~8員環は同一又は異なっても良 5 く、ハロゲン原子、 (C₁-C₆) アルキル基、 (C₁-C₆) アルコキシ基から選択され る 1以上の置換基を有することもできる。又、 R^2 は R^1 と一緒になって=C(T³) T⁴(式中、T³及びT⁴は同一又は異なっても良く、水素原子、C₁-C₆アルキル 基、ハロC1-C6アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、アミノ 基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミ 10 ノ基、モノ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジ (ハロ C1-C6アルキル)アミノ基、フェニル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロ ゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆ アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキ ルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、 15 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキ ルアミノ基、モノ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良いジ C₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC₁-C₆アルキル)アミ ノ基、C1-C6アルコキシカルボニル基又はC1-C6アルキルアミノカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基を示す。)を示すことができ

Qは炭素原子又は窒素原子を示す。

20

る。

Xは同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、アミノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルキール基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカニール基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルスルホニルオキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ

PCT/JP2003/010774

 C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニルアミノ基を示す。

 Σ 、芳香環上の隣接した 2個の Σ は一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基から選択される 1以上の置換基を有することもできる。mは0 ~ 2 0整数を示す。

ェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ

又、芳香環上の隣接した 2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、 該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルカルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、カロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。nは0 ~ 3 $の整数を示す。}$

20 で表されるスルホンアミド誘導体又はその塩類。

2. Aが C_1 - C_6 アルキレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1以上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカコィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカコィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカコィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカコィニル基の登換基を有する置換 C_3 - C_6 アルケニ

WO 2004/018415 PCT/JP2003/010774

59

レン基、 C_3 - C_6 アルキニレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択 される 1 以上の置換基を有する置換 C_3 - C_6 アルキニレン基を示し、 C_1 - C_6 アルキレン基、置換 C_1 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルキニレン基、置換 C_3 - C_6 アルキニレン基又は置換 C_3 - C_6 アルキニレン基中の任意の飽和炭素原子は C_2 - C_5 アルキレン基で置換されて C_3 - C_6 シクロアルカン環を示すこともでき、 C_2 - C_6 アルキレン基、置換 C_2 - C_6 アルキレン基、置換 C_2 - C_6 アルキレン基、置換 C_3 - C_6 アルキレン基、 C_3 - C_6 アルケニレン基又は置換 C_3 - C_6 アルケニレン基又は置換 C_3 - C_6 アルケニレン基スは置換 C_3 - C_6 アルケニレン基内の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基又はアルケニレン基と一緒になって C_3 - C_6 シクロアルカン環又は C_3 - C_6 シクロアルケン環を示すこともでき、

 R^1 が水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、

- 15 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、フェノ
- 20 キシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルチオ基、(C_1 - C_6)アルキルスルスルフィニル基、ハロ(C_1 - C_6)アルキルスルフィニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基、(C_1 - C_6)アルキルスルホニル基又は(C_1 - C_6)アルコキシカルボ25 ニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、

同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 (C_1-C_6) アルキルチオ基、ハロ (C_1-C_6) アルキルチオ基、 (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、ハロ (C_1-C_6) アルキルスルフィニル基、

ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基又は (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6 アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、モノC1-C6アルキルア 5 ミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、C₁-C₆アルキルチオ 基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキ ルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基又はC1-C6アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置 換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シ 10 アノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、 ハロC1-C6アルコキシ基、モノC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い ジC1-C6アルキルアミノ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロC1-C6アルキルチオ基、 C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフィニル基、C₁-C₆アルキ ルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基又はC₁-C₆アルコキシカルボニ 15 ル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以 上の置換基を有する置換C1-C6アルキル基、C3-C6アルケニル基、ハロC3-C6アルケ ニル基、C₃-C₆アルキニル基、ハロC₃-C₆アルキニル基、C₃-C₆シクロアルキル基、 水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、アミノ基、モノ C_1 - C_6 アル キルアミノ基、モノ (ハロC1-C6アルキル) アミノ基、同一又は異なっても良い ミノ基、C1-C6アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆ アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、 ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルス 25 ルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 モノC1-C6アルキルアミノ基、モノ(ハロC1-C6アルキル)アミノ基、同一又は異 なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC1-C6 アルキル)アミノ基、C1-C6アルコキシカルボニル基又はC1-C6アルキルアミノカ ルボニル基から選択される1以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、 ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル スルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカニール基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換 基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良

- 10 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル) アミノ基、同一又は異なっ
- 15 ても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、
- 20 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から 選択される 1 以上の置換基を有する置換ピリジル基を示し、

 R^2 、 R^3 及び R^4 が同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_4 アルコキシ C_1 - C_4 アルキル基又は C_1 - C_4 アルキルチオ C_1 - C_4 アルキル基を示し、又、 R^2 はA又は R^1 と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されて

も良い3~8員環を形成することができ、該3~8員環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基から選択される1以上の置換基を有することもできる。

Qが炭素原子又は窒素原子を示し、

5 Xが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_2 - C_6 アルキニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルオキシ基、 C_1 - C_6 アルキルスルカルボニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基を示し、又、芳香環上の隣接した2個のXは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキルル基、 C_1 - C_6 アルキルルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルカカフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される

1以上の置換基を有することもでき、mが0~2の整数を示し、

 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコ キシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフ ィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又は ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フ 5 ェノキシ基、フェニルチオ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ 基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハ ロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆ アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルス ルホニル基又はハロC₁-C₆アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基 10 を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル 基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、C1-C6アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフ ィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロC1-C6アルキルスルホニル基から 15 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジルオキシ基を示し、又、芳香環上 の隣接した2個のYは一緒になって縮合環を形成することができ、該縮合環は同 一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、シアノ基、C₁-C₆アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アル キルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-20 C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルス ルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)アミノ基、 同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基又は同一若しくは異なっても 良いジ (ハロC1-C6アルキル) アミノ基から選択される1以上の置換基を有する こともでき、nが0~3の整数を示す請求項1記載のスルホンアミド誘導体又は 25 その塩類。

3. Aが C_1 - C_6 アルキレン基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカイニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択

される 1 以上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキレン基を示し、又、 C_1 - C_6 アルキレン基又は置換 C_1 - C_6 アルキレン基中の任意の炭素原子は C_2 - C_5 アルキレン基で置換されて C_3 - C_6 シクロアルカン環を示すこともでき、 C_2 - C_6 アルキレン基又は置換 C_2 - C_6 アルキレン基中の任意の 2 個の炭素原子はアルキレン基と一緒になって C_3 - C_6 シクロアルカン環を示すこともでき、

 R^{1} が水素原子、 C_{1} - C_{6} アルキル基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 シアノ基、ニトロ基、水酸基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アル 10 キルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)ア ミノ基、同一又は異なっても良いジC₁-C₆アルキルアミノ基、同一又は異なって も良いジ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基、C₁-C₆ アルキルアミノカルボニル基、(C₁-C₆)アルキルカルボニルオキシ基、フェノ キシ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C₁-C₆)アルキル基、ハロ (C_1-C_6) アルキル基、 (C_1-C_6) アルコキシ基、ハロ (C_1-C_6) アルコキシ基、 15 (C₁-C₆) アルキルチオ基、ハロ(C₁-C₆) アルキルチオ基、(C₁-C₆) アルキルス ルフィニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルフィニル基、 (C₁-C₆) アルキルスル ホニル基、ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基又は (C₁-C₆) アルコキシカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有するフェノキシ基、フェニルチオ基、 20 同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、(C_1 - C_6)アルキル基、ハロ(C_1 - C_6) アルキル基、 (C₁-C₆) アルコキシ基、ハロ (C₁-C₆) アルコキシ基、 (C₁-C₆) ア ルキルチオ基、ハロ (C₁-C₆) アルキルチオ基、 (C₁-C₆) アルキルスルフィニル 基、ハロ(C₁-C₆)アルキルスルフィニル基、(C₁-C₆)アルキルスルホニル基、 ハロ (C₁-C₆) アルキルスルホニル基又は (C₁-C₆) アルコキシカルボニル基から 25 選択される1以上の置換基を有するフェニルチオ基、フェニル基、同一又は異な っても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6 アルキル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、モノC1-C6アルキルア ミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、C1-C6アルキルチオ 基、ハロC1-C6アルキルチオ基、C1-C6アルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキ

ルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル 基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、

- 5 ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良い ${}^{\circ}$ C $_1$ - C_6 アルキルアミノ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又は C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基から選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基から選択される1以
- 上の置換基を有する置換 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、ハロ C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_3 - C_6 ジクロアルキル基、水酸基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、アミノ基、モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキル)ア
- 15 ミノ基、 C_1 - C_6 アルキルカルボニルアミノ基、フェニルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルカスルカスルカスルカスルカスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、
- 20 モノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、 C_1 - C_6 アルコキシカルボニル基又は C_1 - C_6 アルキルアミノカルボニル基から選択される 1 以上の置換基を環上に有する置換フェニルアミノ基、ベンゾイルアミノ基、同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニト
- 25 ロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、モノ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、エノ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、モノ(ハロ C_1 - C_6 アルキル)アミノ基、同一又は異なっても良いジ C_1 - C_6 アルキルアミノ基、

同一又は異なっても良いジ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカ ルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボニル基から選択される1以上の置換 基を環上に有する置換ベンゾイルアミノ基、フェニル基、同一又は異なっても良 く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アルキル基、ハロC1-C6アルキル 5 基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、C₁-C₆アルキルチオ基、ハロ C₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルフ イニル基、C₁-C₆アルキルスルホニル基、ハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、モノ C₁-C₆アルキルアミノ基、モノ (ハロC₁-C₆アルキル) アミノ基、同一又は異なっ ても良いジC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なっても良いジ(ハロC1-C6アル 10 キル) アミノ基、C₁-C₆アルコキシカルボニル基又はC₁-C₆アルキルアミノカルボ ニル基から選択される1以上の置換基を有する置換フェニル基、ピリジル基又は 同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C1-C6アル キル基、ハロC₁-C₆アルキル基、C₁-C₆アルコキシ基、ハロC₁-C₆アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 キルスルホニル基、モノC₁-C₆アルキルアミノ基、モノ(ハロC₁-C₆アルキル)ア ミノ基、同一又は異なっても良いジC1-C6アルキルアミノ基、同一又は異なって も良いジ(ハロC₁-C₆アルキル)アミノ基又はC₁-C₆アルコキシカルボニル基から 選択される1以上の置換基を有する置換ピリジル基を示し、

 R^2 、 R^3 及び R^4 が同一又は異なっても良く、水素原子、 C_1 - C_6 アルキル基、 C_3 - C_6 アルケニル基、 C_3 - C_6 アルキニル基、 C_1 - C_4 アルコキシ C_1 - C_4 アルキル基又は C_1 - C_4 アルキルチオ C_1 - C_4 アルキル基を示し、又、 R^2 はA又は R^1 と結合して、 $1\sim 3$ 個の同一又は異なっても良い酸素原子、硫黄原子又は窒素原子により中断されても良い $3\sim 8$ 員環を形成することができ、該 $3\sim 8$ 員環は同一又は異なっても良 く、ハロゲン原子、(C_1 - C_6)アルキル基、(C_1 - C_6)アルコキシ基から選択される 1以上の置換基を有することもできる。

Qが炭素原子又は窒素原子を示し、

Xが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_2 - C_6 アルケニル基、ハロ C_2 - C_6 アルケニル基、 C_2 - C_6 アルケニル

Yが同一又は異なっても良く、ハロゲン原子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 ア ルコキシC₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アルキル基、ヒドロキシハロC₁-C₆アルキル 15 基、 C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アル キル基、C1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシ基、ハロC1-C6アルコキシハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 ア ルキルスルフィニル基、ハロC1-C6アルキルスルフィニル基、C1-C6アルキルスル ホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アル 20 キルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシハロC₁-C₆アルキルスルホニル基、フェノキシ基、同一又は異なって も良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、ハロC₁-C₆アル キル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハ ロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁-C₆アルキルスル フィニル基、C1-C6アルキルスルホニル基又はハロC1-C6アルキルスルホニル基か 25 ら選択される1以上の置換基を有する置換フェノキシ基、フェニルチオ基、同― 又は異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、C₁-C₆アルキル基、 ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アル キルチオ基、ハロC₁-C₆アルキルチオ基、C₁-C₆アルキルスルフィニル基、ハロC₁- C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される 1 以上の置換基を有する置換フェニルチオ基、ピリジルオキシ基又は同一若しくは異なっても良く、ハロゲン原子、シアノ基、ニトロ基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6

- 5 アルコキシ基、 C_1 - C_6 アルキルチオ基、 O_1 - O_6 アルキルチオ基、 O_1 - O_6 アルキルスルフィニル基、 O_1 - O_6 アルキルスルホニル基又は O_1 - O_6 アルキルスルホニル基から選択される O_1 - O_6 - O_6 アルキルスルホニル基から選択される O_1 - O_6 - O_6
- 10 子、 C_1 - C_6 アルキル基、ハロ C_1 - C_6 アルキル基、 C_1 - C_6 アルコキシ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、ハロ C_1 - C_6 アルキルチオ基、 C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、ハロ C_1 - C_6 アルキルスルフィニル基、 C_1 - C_6 アルキルスルホニル基又はハロ C_1 - C_6 アルキルスルホニル基から選択される1以上の置換基を有することもでき、nが0~3の整数を示す請求項1記載のスルホンアミド誘導体又はその塩類。
 - 4. 請求項1乃至3記載の一般式(I)で表されるスルホンアミド誘導体又は その塩類を有効成分として含有することを特徴とする農園芸用殺虫剤。
- 5. 有用植物から害虫を防除するため請求項4記載の農園芸用殺虫剤の有効量 を対象作物植物体、土壌又は水田に処理することを特徴とする農園芸用殺虫剤の 20 使用方法。

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.

PCT/JP03/10774

F				
A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER Int.Cl ⁷ C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49,				
int.	.CI CO/C311/46, 311/48, 311/4	9, 311/50, 317/28, 323/	49,	
	C07D213/75, 213/42, 279/1	2, A01N41/06, 43/40, 47	/02	
According (to International Patent Classification (IPC) or to both n	estional electification and IBC	•	
i		autonal classification and if C		
	S SEARCHED			
Minimum d	ocumentation searched (classification system followed	by classification symbols)		
Int.	Cl ⁷ C07C311/46, 311/48, 311/4	9, 311/50, 317/28, 323/	49,	
l	C07D213/75, 213/42, 279/1	2, A01N41/06, 43/40, 47	/02	
Dogimento	tion searched other than minimum documentation to th			
Documenta	tion searched objet than minimum documentation to th	e extent that such documents are included	in the fields searched	
	lata base consulted during the international search (nam	ne of data base and, where practicable, sea	rch terms used)	
REGI	STRY(STN), CA(STN)			
C DOCII	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT			
C. DOCO	MENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
Category*	Citation of document, with indication, where a	ppropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.	
P,X	WO 03/11028 Al (Nissan Chemi	cal Industries	1-5	
	Ltd.),	icai industries,	1-3	
	13 February, 2003 (13.02.03)	_		
	(Family: none)			
	(ranzzy: none,			
P,X	WO 02/94766 Al (Nihon Nohya)	cu Co., Ltd.).	1-5	
•	28 November, 2002 (28.11.02)			
	& JP 2003-34672 A	•		
			:	
х	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohya)	cu Co., Ltd.),	1-5	
	28 June, 2001 (28.06.01),	,,	_ •	
	& JP 2001-240580 A & EP	1241159 A1		
	•			
D Roat	- January 1 of the Control of the Co			
L Future	er documents are listed in the continuation of Box C.	See patent family annex.		
	categories of cited documents:	"T" later document published after the into	emational filing date or	
	ent defining the general state of the art which is not	priority date and not in conflict with the		
	considered to be of particular relevance understand the principle or theory underlying the invention "E" earlier document but published on or after the international filing "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot			
date considered novel or cannot be considered to involve an inventive				
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be				
special reason (as specified) considered to involve an inventive step when the document is				
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other combined with one or more other such documents, such				
recans combination being obvious to a person skilled in the art document published prior to the international filing date but later "&" document member of the same patent family				
than the priority date claimed				
Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report				
26 N	ovember, 2003 (26.11.03)	16 December, 2003 ((16.12.03)	
•				
Name and m	ailing address of the ISA/	Authorized officer		
	nese Patent Office	Annonized officer		
F	722400			
Facsimile No).	Telephone No.		

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 1998)

A. 発明の原	属する分野の分類(国際特許分類(IPC))			
Int. C17 C07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/49, C07D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06, 43/40, 47/02				
B. 調査を行				
	d小限資料(国際特許分類(IPC))		· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	
Int. Cl' C	07C311/46, 311/48, 311/49, 311/50, 317/28, 323/4 -	9, CO7D213/75, 213/42, 279/12, A01N41/06	, 43/40, 47/02	
最小限資料以外	トの資料で調査を行った分野に含まれるもの			
国院調金で使用	用した電子データベース(データベースの名称、	調査に使用した用語)		
	REGISTRY (STN), CA (STN)			
<u>C. 関連する</u> 引用文献の	ると認められる文献 		関連する	
カテゴリー*	引用文献名 及び一部の箇所が関連すると	ときは、その関連する箇所の表示	請求の範囲の番号	
Р, Х	WO 03/11028 A1(Nissan Chemical In (ファミリーなし).	ndustries, Ltd.)2003.02.13	1-5	
Р, Х	WO 02/94766 A1(Nihon Nohyaku Co., & JP 2003-34672 A	Ltd.)2002.11.28	1-5	
X	WO 01/46124 A1 (Nihon Nohyaku Co., Ltd.)2001.06.28 & JP 2001-240580 A & EP 1241159 A1		1-5	
□ C欄の続き	きにも文献が列挙されている。	□ パテントファミリーに関する別	紙を参照。	
* 引用文献のカテゴリー 「A」特に関連のある文献ではなく、一般的技術水準を示すもの 「E」国際出願日前の出願または特許であるが、国際出願日以後に公表されたもの 「L」優先権主張に疑義を提起する文献又は他の文献の発行日若しくは他の特別な理由を確立するために引用する文献(理由を付す) 「O」口頭による開示、使用、展示等に言及する文献「P」国際出願日前で、かつ優先権の主張の基礎となる出願		の日の後に公表された文献 「T」国際出願日又は優先日後に公表された文献であって出願と矛盾するものではなく、発明の原理又は理論の理解のために引用するもの「X」特に関連のある文献であって、当該文献のみで発明の新規性又は進歩性がないと考えられるもの「Y」特に関連のある文献であって、当該文献と他の1以上の文献との、当業者にとって自明である組合せによって進歩性がないと考えられるもの「&」同一パテントファミリー文献		
国際調査を完了	7した日 26.11.03	国際調査報告の発送日 16.1	2,03	
日本国	D名称及びあて先 国特許庁 (ISA/JP) 郵便番号100-8915	特許庁審査官(権限のある職員) 前田 憲彦 印	4H 8318	
	事候番 5 1 0 0 一 6 9 1 5 第千代田区霞が関三丁目 4 番 3 号	電話番号 03-3581-1101	内線 3443	